

【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21年11月5日 (2009.11.5)

【公表番号】特表2009-509989(P2009-509989A)

【公表日】平成21年3月12日 (2009.3.12)

【年通号数】公開・登録公報2009-010

【出願番号】特願2008-532648(P2008-532648)

【国際特許分類】

C 07 D 417/10 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

C 07 D 417/12 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

【F I】

C 07 D 417/10

A 61 P 3/00

A 61 P 3/10

A 61 P 3/06

A 61 P 3/04

A 61 P 9/12

A 61 P 25/00

A 61 P 25/28

C 07 D 417/12 C S P

A 61 K 31/427

C 07 D 417/14

A 61 K 31/454

A 61 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月11日 (2009.9.11)

【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

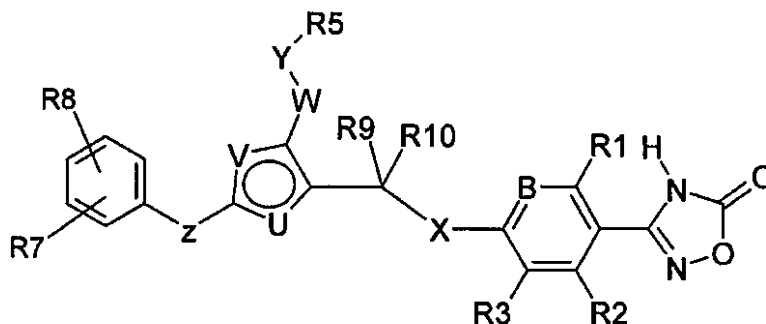
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

## 【化 1】



式 I

の化合物、全てのその立体異性体、エナンチオマー体及び任意の割合での混合物、並びに生理学的に許容されるその塩及び互変異性体。

上記式中、

R 1 は、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、S C H<sub>3</sub>、C N、(C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリールであり、ここで、アルキル、アルキレン及びアリールは無置換、又は F により 1 から 5 重に置換され；

B は、C (R 4) 又は N であり；

R 2、R 3 は、独立に、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、S C H<sub>3</sub>、C N、(C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリールであり、ここで、アルキル、アルキレン及びアリールは無置換、又は F により 1 から 5 重に置換され；

R 2 及び R 3 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、(C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール又は (C<sub>5</sub> - C<sub>10</sub>) ヘテロアリール環を形成し；

R 4 は、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、S C H<sub>3</sub>、C N、(C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリールであり、ここで、アルキル、アルキレン及びアリールは、無置換、又は F により 1 から 5 重に置換され；

X は、O、S、S (O)、S (O)<sub>2</sub>、O - C H<sub>2</sub>、S - C H<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub> - O、C H<sub>2</sub> - S； - C H<sub>2</sub> - であり；

Z は、結合、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキレン、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>) アルケニレン、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>) アルキリデン、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキレン - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

U 及び V の内の一方が N であり、他方が S 又は O であり；

W は、結合、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキレン、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>) アルケニレンであり、ここで、アルキレン及びアルケニレンは無置換、又は O H 及び F により一、二若しくは三置換され；

Y は、結合、O、S、S (O)、S (O)<sub>2</sub>、N (R 6) であり；そして、

R 5 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub>) アリール、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>) アルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリールであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、F、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル及び O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H により一、二又は三置換されても良く、そして、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、F、C l、B r、C F<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル及び O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H により一、二又は三置換され；

R 6 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>) アルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキル及びアルケニルは無置換、又は F 及び O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H により一、二若しくは三置換され；

R 5 及び R 6 は、それらが結合している窒素原子と一緒になり ( $Y = N(R 6)$ )、( $C_3 - C_9$ ) - ヘテロシクロアルキル、( $C_3 - C_9$ ) - ヘテロシクロアルケニル又は ( $C_5 - C_9$ ) - ヘテロアリールを形成し、それは更に、1 から 3 個のヘテロ原子 N、O、S を含んで良く、そしてそれは無置換、又は F、 $CF_3$ 、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、O - ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、 $CH_2 - OH$ 、 $SO_2 - (C_1 - C_4)$  アルキル、CO - ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、CO -  $NH_2$ 、NH - CO - ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_6 - C_{14}$ ) アリール及び ( $C_5 - C_{15}$ ) ヘテロアリールにより一若しくは二置換され；

R 7、R 8 は、独立に、H、ハロゲン、( $C_1 - C_8$ ) アルキル、( $C_0 - C_4$ ) アルキレン - O - ( $C_0 - C_4$ ) アルキレン - H、 $SCF_3$ 、 $SF_5$ 、 $S(O)_2CF_3$ 、( $C_0 - C_4$ ) アルキレン - O - ( $C_6 - C_{12}$ ) アリール、( $C_0 - C_4$ ) アルキレン - ( $C_6 - C_{12}$ ) アリール、 $NO_2$  から成るグループから選択され、ここで、アルキル及びアルキレンは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され、そしてアリールは無置換、又はハロゲン、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、若しくは O - ( $C_1 - C_4$ ) アルキルにより一、二若しくは三置換され；

R 9 は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_6 - C_{14}$ ) アリール、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_5 - C_{15}$ ) ヘテロアリール、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルケニルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され、そして、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びシクロアルケニルは無置換、又はハロゲン、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、若しくは O - ( $C_1 - C_4$ ) アルキルにより一、二若しくは三置換され；

R 10 は、H、F、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_6 - C_{14}$ ) アリール、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_5 - C_{15}$ ) ヘテロアリール、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_0 - C_6$ ) アルキレン - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルケニルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され、そして、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びシクロアルケニルは無置換、又はハロゲン、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$  若しくは O - ( $C_1 - C_4$ ) アルキルにより一、二若しくは三置換される。

【請求項 2】

B は、C (R 4) であり；そして

R 4 は、H である；

請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 3】

X は、O、O -  $CH_2$  である；

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物。

【請求項 4】

R 1 は、H、ハロゲン、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_0 - C_4$ ) アルキレン - O - ( $C_0 - C_2$ ) アルキレン - H、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、フェニルであり、ここで、アルキル、アルキレン及びフェニルは無置換、又は F により一、二若しくは三置換される；

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 5】

R 2 は、H であり；そして

R 3 は、H、F である；

又は

R 2 及び R 3 は、それらが結合している C 原子と一緒になり、( $C_6$ ) - アリール若しくは ( $C_5 - C_6$ ) ヘテロアリール環を形成する；

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 6】

W は、 $CH_2$  であり；

Y は、結合であり；

R 5 は、H である；

請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 7】

Z は、結合である；

請求項 1 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 8】

U は、S であり、そして

V は、N である；

請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 9】

R 7 は、F、C<sub>1</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレン - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレン - H、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - フェニルであり、ここで、アルキル、アルキレン及びフェニルは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；そして

R 8 は、H である；

請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 10】

R 9 は、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>) ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され、そして、アリール、ヘテロアリール及びシクロアルキルは無置換、又はハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、-CF<sub>3</sub>、-CHF<sub>2</sub>若しくは O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルにより一、二若しくは三置換され；

R 10 は、H である；

請求項 1 ～ 9 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 11】

W は、結合、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレンであり；

Y は、結合、N(R 6) であり；そして

R 5 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルであり、ここで、アルキルは、F により一、二若しくは三置換されても良く；

R 6 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルであり、ここで、アルキルは、F により一、二若しくは三置換されても良く；

R 5 及び R 6 は、それらが結合している窒素原子と一緒に (Y = N(R 6))、(C<sub>4</sub> - C<sub>6</sub>) - ヘテロシクロアルキルを形成し、それは、更に 1 から 2 個のヘテロ原子 N、O、S を含んで良く、そしてそれは無置換、又は F、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルにより一若しくは二置換される；

請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 12】

式中、1 つ又はそれ以上の置換基が以下の意味：

R 1 は、H、ハロゲン、OH、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキルは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；

R 2 は、H であり；

R 3 は、H、F であり；

B は、C(R 4) であり；

R 4 は、H であり；

X は、O、O - CH<sub>2</sub> であり；

V は、N であり；

U は、O、S であり；

W は、結合、CH<sub>2</sub> であり；

Y は、結合、N(R 6) であり；

R 5 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルであり、ここで、アルキルは、F により一、二又は

三置換されても良く；

R 6 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルであり、ここで、アルキルは、F により一、二又は三置換されても良く；

R 5 及び R 6 は、それらが結合している窒素原子と一緒になり (Y = N (R 6))、(C<sub>4</sub> - C<sub>6</sub>) - ヘテロシクロアルキルを形成し、それは、更に 1 から 2 個のヘテロ原子 N、O、S を含んでも良く、そしてそれは無置換、又は F、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルにより一若しくは二置換され；好ましくは、無置換又は F、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルにより一若しくは二置換されたピペリジンであり；最も好ましくは、CF<sub>3</sub> により一置換されたピペリジンであり；

Z は、結合であり；

R 7 は、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、フェニルであり、ここで、アルキル及びフェニルは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；

R 8 は H であり；

R 9 は、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - フェニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>) ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルキレン、フェニル及びヘテロアリールは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；

R 10 は、H である；

を有する請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 13】

式中、1 つ又はそれ以上の置換基が以下の意味：

R 1 は、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレン - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキレン及びアルキルは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；

R 2 は、H であり；

R 3 は、H、F であり；

B は、C (R 4) であり；

R 4 は、H であり；

X は、O、O - CH<sub>2</sub> であり；

V は、N であり；

U は、O、S であり；

W は、CH<sub>2</sub> であり；

Y は、結合であり；

R 5 は、H であり；

Z は、結合であり；

R 7 は、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、フェニルであり、ここで、アルキル及びフェニルは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；

R 8 は、H であり；

R 9 は、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - フェニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>) ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルキレン、フェニル、シクロアルキル及びヘテロアリールは無置換、又は F により一、二若しくは三置換され；

R 10 は、H である；

を有する請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 14】

式中、1 つ又はそれ以上の置換基が、以下の意味：

B は、C (R 4)、N であり；

R 1 は、H、F、Cl、Br、OH、O - CH<sub>3</sub>、O - CHF<sub>2</sub>、O - CH<sub>2</sub> - CF<sub>3</sub>、C

$F_3$ 、 $CH_2-CH_3$ 、 $CH_2-O-CH_2-CF_3$ 、 $CH_2-O-CH_3$ 、 $CH_2-O-CH_2-CH_3$ 、シクロプロピルであり；

R 2 は、H であり；

R 3 は、H、F であり；

R 4 は、H であり；

R 2 及び R 3 は、それらが結合している C 原子及びそれらを有する環と一緒にあって、ナフタレン又はキノリン環を形成し、

X は、O、 $CH_2$ 、 $O-CH_2$  であり；

V は、N であり；

U は、S であり；

W は、 $CH_2$  であり；

Y は、結合、N ( R 6 ) であり；

R 5 は、H であり；

R 5 及び R 6 は、それらが結合している窒素原子と一緒になり (  $Y = N ( R 6 )$  )、 $CF_3$  で一置換されたピペリジンを形成し；

Z は、結合であり；

R 7 は、 $CF_3$  であり；

R 8 は、H であり；

R 9 は、 $CH_3$ 、 $CH_2CH_3$ 、 $C_3H_7$ 、 $C_4H_9$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2-CH_2-CH_3$ 、フェニル、 $CH_2$ -フェニル、 $CH_2-CH_2$ -フェニル、 $CH_2-4-F$ -フェニル、 $CH_2$ -ピリジル、 $CF_2$ -シクロプロピル、 $CF_2-4-CHF_2$ -フェニルであり；

R 10 は、H である；

を有する請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の 1 つ又はそれ以上の式 I の化合物を含む医薬品。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の 1 つ又はそれ以上の式 I の化合物、及び 1 つ又はそれ以上の抗糖尿病薬を含む医薬品。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の 1 つ又はそれ以上の式 I の化合物、及び 1 つ又はそれ以上の脂質モジュレーターを含む医薬品。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、脂肪酸代謝の障害及びグルコース利用障害の治療又は予防のための医薬。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、インスリン抵抗性が関与する障害の治療又は予防のための医薬。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、糖尿病に伴う続発症の予防を含む糖尿病の治療又は予防のための医薬。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、異脂肪血症及びその後遺症の治療又は予防のための医薬。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、メタボリックシンドロームに関連する可能性のある状態の治療又は予防のための医薬。

【請求項 23】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、中枢及び末梢神経系の脱髄疾患及び他の神経変性障害の治療又は予防のための医薬。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0047

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0047】

用語ヘテロ環は、当然ながら、単環又は二環の、縮合環、橋掛け環又はスピロ環であって、3～15個の炭素原子を含有する、飽和の（ヘテロシクロアルキル）、部分飽和の（ヘテロシクロアルケニル）又は不飽和の（ヘテロアリール）炭化水素環を意味し、ここで、3～15個の環炭素原子のうち、1～5個の炭素原子は窒素、酸素又は硫黄の様なヘテロ原子で置換され、更に、このヘテロ原子は、例えば、N=O、S=O、SO<sub>2</sub>の様に酸化されても良い。ヘテロ環の例としては、アクリジニル、アザインドール（1H-ピロピリジニル）、アザベンゾイミダゾリル、アザスピロデカニル、アゼピニル、アゼチジニル、アジリジニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾフラニル、ジヒドロベンゾフラニル、ベンゾチオフラニル、ベンゾチオフエニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾテトラゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、カルバゾリル、4aH-カルバゾリル、カルボリニル、クロマニル、クロメニル、シンノリニル、デカヒドロシンノリニル、4,5-ジヒドロオキサゾリニル、ジオキサゾリル、ジオキサジニル、1,3-ジオキサラニル、1,3-ジオキサソレニル、3,3-ジオキソ[1,3,4]オキサチアジニル、6H-1,5,2-ジチアジニル、ジヒドロフロ[2,3-b]-テトラヒドロフラニル、フラニル、フラザニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリル、1H-インダゾリル、インドリニル、インドリジニル、インドリル、3H-インドリル、イソベンゾフラニル、イソクロマニル、イソインダゾリル、イソインドリニル、イソインドリル、イソキノリニル（ベンゾイミダゾリル）、イソチアゾリル、イソチアゾリジニル、イソチアゾリニル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリニル、イソオキサゾリジニル、2-イソオキサゾリニル、ケトピペラジニル、モルホリニル、ナフチリジニル、オクタヒドロイソキノリニル、オキサジアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2-オキサ-チエパニル、1,2-オキサチオラニル、1,4-オキサゼパニル、1,4-オキサゼピニル、1,2-オキサジニル、1,3-オキサジニル、1,4-オキサジニル、オキサゾリジニル、オキサゾリニル、オキサゾリル、オキセタニル、オキソカニル、フェナントリジニル、フェナントロリニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサチイニル、フェノキサジニル、フタラジニル、ピペラジニル、ピペリジニル、プテリジニル、プリニル、ピラニル、ピラジニル、ピラゾリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリドオキサゾリル、ピリドイミダゾリル、ピリドチアゾリル、ピリジニル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピロリニル、2H-ピロリル、ピロリル、キナゾリニル、キノリニル、4H-キノリジニル、キノキサリニル、キヌクリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロピリジニル、テトラヒドロチオフエニル、テトラジニル、テトラゾリル、6H-1,2,5-チアジアジニル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、チアントレニル、1,2-チアジニル、1,3-チアジニル、1,4-チアジニル、1,3-チアゾリル、チアゾリル、チアゾリジニル、チアゾリニル、チエニル、チエタニル、チエノチアゾリル、チエノオキサゾリル、チエノイミダゾリル、チオモルホリニル、チオフエノリル、チオフエニル、チオピラニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,5-トリアゾリル、1,3,4-トリアゾリル及びキサンテニルがある。

## 【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 4 8

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 4 8 】

ヘテロ環は、無置換、又は、例えば、F、Cl、Br、I、CF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、CO-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、CO-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキレン-H、CO-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、CON((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-アリール、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、O-(C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、O-CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、O-CO-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、O-CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、O-CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、O-CO-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、O-CO-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H、O-CO-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、O-CO-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、S-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、S-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、S-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、S-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、SO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、SO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、SO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、SO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、SO<sub>2</sub>-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、SO<sub>2</sub>-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、SO<sub>2</sub>-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、SO<sub>2</sub>-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリール、SO<sub>2</sub>-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H、SO<sub>2</sub>-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、SO<sub>2</sub>-N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環の様な適切な基で一、二又は三置換され、ここで、アリール環又はヘテロ環は、無置換、又はF、Cl、Br、OH、CF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、OCF<sub>3</sub>、O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレン-H、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-アリール、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-アリール、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>)ヘテロ環、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-アリール、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-H)-CO-O-(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン-(C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub>)シクロアルキル、N((C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレン

- H) - CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロ環、N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - CO - N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>12</sub>) - アリール、N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - CO - N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - CO - N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - CO - N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロ環により一又は二置換され、ここで、アリール環又はヘテロ環は、無置換、又はF、Cl、Br、I、OH、CF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、OCF<sub>3</sub>、O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、N ( (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H、SO<sub>2</sub> - CH<sub>3</sub>、COOH、COO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、SF<sub>5</sub>、CONH<sub>2</sub>により、一又は二置換される。