

【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7月19日(2018.7.19)

【公開番号】特開2018-87232(P2018-87232A)

【公開日】平成30年6月7日(2018.6.7)

【年通号数】公開・登録公報2018-021

【出願番号】特願2018-28160(P2018-28160)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 K 31/4035 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 K 31/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/453 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 277/64 (2006.01)

C 0 7 D 207/12 (2006.01)

C 0 7 D 317/58 (2006.01)

C 0 7 D 319/18 (2006.01)

C 0 7 D 319/20 (2006.01)

C 0 7 D 333/20 (2006.01)

C 0 7 D 333/28 (2006.01)

C 0 7 D 217/16 (2006.01)

C 0 7 D 487/08 (2006.01)

C 0 7 D 213/40 (2006.01)

C 0 7 D 263/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 295/13 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	207/10	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 K	31/357	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/4025	
A 6 1 K	31/4035	
A 6 1 K	31/407	
A 6 1 K	31/4192	
A 6 1 K	31/42	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/428	
A 6 1 K	31/4402	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/453	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/5377	
C 0 7 D	277/64	C S P
C 0 7 D	207/12	
C 0 7 D	317/58	
C 0 7 D	319/18	
C 0 7 D	319/20	
C 0 7 D	333/20	
C 0 7 D	333/28	
C 0 7 D	217/16	
C 0 7 D	487/08	
C 0 7 D	213/40	
C 0 7 D	263/06	
C 0 7 D	405/06	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	407/12	
C 0 7 D	409/12	
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	413/04	
C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	295/13	

【手続補正書】

【提出日】平成30年5月30日(2018.5.30)

【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

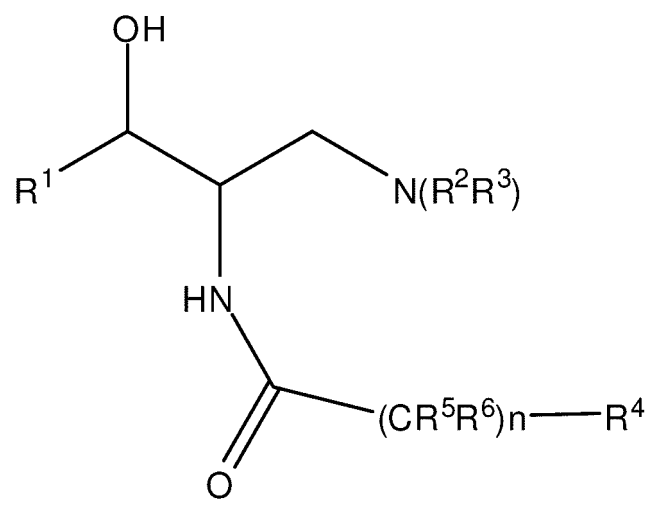
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の構造式：

【化 1】



(式中、

R^1 が、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、 Ar^1 、 $-OR^{30}$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^{30}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NCS$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-NR^{31}C(O)R^{30}$ 、 $-NR^{31}C(O)OR^{32}$ 、 $-N(R^{31})C(O)N(R^{31})_2$ 、 $-C(O)R^{30}$ 、 $-C(S)R^{30}$ 、 $-C(O)OR^{30}$ 、 $-OC(O)R^{30}$ 、 $-C(O)N(R^{31})_2$ 、 $-S(O)_2R^{30}$ 、 $-SO_2N(R^{31})_2$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-SO_3R^{30}$ 、 $-NR^{31}SO_2N(R^{31})_2$ 、 $-NR^{31}SO_2R^{32}$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-V_0$ 、 $-OR^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-V_0$ 、 $-SR^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-NO_2$ 、 $-V_0$ 、 $-CN$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-V_0$ 、 $-NR^{31}C(O)R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-NR^{31}CO_2R^{32}$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})C(O)N(R^{31})_2$ 、 $-V_0$ 、 $-C(O)R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-C(S)R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-CO_2R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-OC(O)R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-C(O)N(R^{31})_2$ 、 $-V_0$ 、 $-S(O)_2R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-SO_2N(R^{31})_2$ 、 $-V_0$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-V_0$ 、 $-SO_3R^{30}$ 、 $-V_0$ 、 $-NR^{31}SO_2N(R^{31})_2$ 、 $-V_0$ 、 $-NR^{31}SO_2R^{32}$ 、 $-O$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-O$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-S$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-S$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-N(R^{31})$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-N(R^{31})$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-NR^{31}C(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-NR^{31}C(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-C(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-C(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-C(S)$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-C(S)$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-C(O)O$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-C(O)O$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-O$ 、 $-C(O)$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-O$ 、 $-C(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-C(O)N(R^{31})$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-C(O)N(R^{31})$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-S(O)_2$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-S(O)_2$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-SO_2N(R^{31})$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-SO_2N(R^{31})$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-S(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-S(O)$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-S(O)_2$ 、 $-O$ 、 $-V_1$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-S(O)_2$ 、 $-O$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-NR^{31}SO_2$ 、 $-V_0$ 、 $-N(R^{31})_2$ 、 $-NR^{31}SO_2$ 、 $-V_0$ 、 $-Ar^1$ 、 $-O$ 、 $-[CH_2]_p$ 、 $-O$ 、 $-S$ 、 $-[CH_2]_p$ 、 $-S$ 、および $-[CH_2]_q$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアリール基であり；

各 V_0 が、独立して、C1～C10アルキレン基であり；

各 V_1 が、独立して、C2～C10アルキレン基であり；

Ar^1 が、各々が独立して、ハロゲン、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、ハロアルコキシ、アルコシカル

ポニル、アルキルカルボニルおよびハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアリール基であり；

各 $R^{3\ 0}$ が、独立して、

i) 水素；

ii) ハロゲン、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、ハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルおよびハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアリール基；または

iii) ハロゲン、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、ハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニルおよびハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアルキル基であり；

各 $R^{3\ 1}$ が、独立して、 $R^{3\ 0}$ 、 $-CO_2R^{3\ 0}$ 、 $-SO_2R^{3\ 0}$ もしくは $-C(O)R^{3\ 0}$ であり；または

$-N(R^{3\ 1})_2$ が一緒になって、任意に置換される非芳香族複素環基であり；

各 $R^{3\ 2}$ が、独立して；

i) ハロゲン、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルおよびハロアルコキシおよびハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアリール基；または

ii) ハロゲン、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルおよびハロアルコキシおよびハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアルキル基であり；

各 p が、独立して、1、2、3 または 4 であり；

各 q が、独立して、3、4、5 または 6 であり；

$-N(R^2R^3)$ が、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、 $-OR^{4\ 0}$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^{4\ 0}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-NR^{4\ 1}C(O)R^{4\ 0}$ 、 $-NR^{4\ 1}C(O)OR^{4\ 2}$ 、 $-N(R^{4\ 1})C(O)N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-C(O)R^{4\ 0}$ 、 $-C(S)R^{4\ 0}$ 、 $-C(O)OR^{4\ 0}$ 、 $-OC(O)R^{4\ 0}$ 、 $-C(O)N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-S(O)_2R^{4\ 0}$ 、 $-SO_2N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-S(O)R^{4\ 2}$ 、 $-SO_3R^{4\ 0}$ 、 Ar^2 、 V_2 、 $-Ar^2$ 、 $-V_2$ 、 $-OR^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-V_2$ 、 $-SR^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-V_2$ 、 $-CN$ 、 $-V_2$ 、 $-N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-V_2$ 、 $-NR^{4\ 1}C(O)R^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-NR^{4\ 1}CO_2R^{4\ 2}$ 、 $-V_2$ 、 $-N(R^{4\ 1})C(O)N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-V_2$ 、 $-C(O)R^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-C(S)R^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-CO_2R^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-OC(O)R^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-C(O)N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-V_2$ 、 $-S(O)_2R^{4\ 0}$ 、 $-V_2$ 、 $-SO_2N(R^{4\ 1})_2$ 、 $-V_2$ 、 $-S(O)R^{4\ 2}$ 、 $-V_2$ 、 $-SO_3R^{4\ 0}$ 、 $-O$ 、 $-V_2$ 、 $-Ar^2$ および $-S$ 、 $-V_2$ 、 $-Ar^2$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換される 5 員または 6 員非芳香族窒素含有複素環基であり；

各 V_2 が、独立して、C1～C4 アルキレン基であり；

Ar^2 が、ハロゲン、C1～C6 アルキル、アミノ、C1～C6 アルキルアミノ、C1～C6 ジアルキルアミノ、C1～C6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C1～C6 ハロアルコキシ、C1～C6 アルコキシカルボニル、C1～C6 アルキルカルボニルおよび C1～C6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で各々が任意に置換されるアリール基であり；

各 $R^{4\ 0}$ が、独立して、

i) 水素；

ii) ハロゲン、C1～C6 アルキル、アミノ、C1～C6 アルキルアミノ、C1～C6 ジアルキルアミノ、C1～C6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C1～C6 ハロアルコキシ、C1～C6 アルコキシカルボニル、C1～C6 アルキルカルボニルお

よび C 1 ~ C 6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアリール基；または

i i i) ハロゲン、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキルアミノ、C 1 ~ C 6 ジアルキルアミノ、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルコキシカルボニル、C 1 ~ C 6 アルキルカルボニルおよび C 1 ~ C 6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換される C 1 ~ C 10 アルキル基であり；

各 $R^{4\ 1}$ が、独立して、 $R^{4\ 0}$ 、 $-CO_2R^{4\ 0}$ 、 $-SO_2R^{4\ 0}$ もしくは $-C(O)R^{4\ 0}$ であるか；または

$-N(R^{4\ 1})_2$ が一緒になって、任意に置換される非芳香族複素環基であり；

各 $R^{4\ 2}$ が、独立して；

i) ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキルアミノ、C 1 ~ C 6 ジアルキルアミノ、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルコキシカルボニル、C 1 ~ C 6 アルキルカルボニルおよび C 1 ~ C 6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるアリール基；または

i i) ハロゲン、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキルアミノ、C 1 ~ C 6 ジアルキルアミノ、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルコキシカルボニル、C 1 ~ C 6 アルキルカルボニルおよび C 1 ~ C 6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換される C 1 ~ C 10 アルキル基であり；

R^5 および R^6 が、各々、独立して、 $-H$ ； $-OH$ ；ハロゲン；または低級アルコキシまたは低級アルキル基であり；

n が、1、2、3、4、5 または 6 であり；ならびに

R^4 が、任意に置換されるアリール基である）

によって表される多発性嚢胞腎疾患の治療における使用のための化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

R^1 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、 $-OR^{3\ 0}$ 、 $-SR^{3\ 0}$ 、 $-N(R^{3\ 1})_2$ 、 Ar^1 、 $-V_0-OR^{3\ 0}$ 、 $-V_0-N(R^{3\ 1})_2$ 、 $-V_0-Ar^1$ 、 $-O-V_0-Ar^1$ 、 $-O-V_1-N(R^{3\ 1})_2$ 、 $-S-V_0-Ar^1$ 、 $-S-V_1-N(R^{3\ 1})_2$ 、 $-N(R^{3\ 1})-V_0-Ar^1$ 、 $-N(R^{3\ 1})-V_1-N(R^{3\ 1})_2$ 、 $-O-[CH_2]_p-O-$ 、 $-S-[CH_2]_p-S-$ および $-[CH_2]_q-$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるフェニル基であり；

Ar^1 が、ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキルアミノ、C 1 ~ C 6 ジアルキルアミノ、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルコキシカルボニル、C 1 ~ C 6 アルキルカルボニルおよび C 1 ~ C 6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で各々が任意に置換されるフェニル基であり；

各 $R^{3\ 0}$ が、独立して、

i) 水素；

i i) ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキルアミノ、C 1 ~ C 6 ジアルキルアミノ、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルコキシカルボニル、C 1 ~ C 6 アルキルカルボニルおよび C 1 ~ C 6 ハロアルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるフェニル基；または

i i i) ハロゲン、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキルアミノ、C 1 ~ C 6 ジアルキルアミノ、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、C 1 ~ C 6 アルコキシカルボニル、C 1 ~ C 6 アルキルカルボニルおよび C 1 ~ C 6 ハロ

アルキルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換される C 1 ~ C 10 アルキル基であり；ならびに

各 $R^{3\ 1}$ が、独立して、 $R^{3\ 0}$ であるか、または、 $-N(R^{3\ 1})_2$ が任意に置換される非芳香族複素環基である、
請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$-N(R^2 R^3)$ が、ハロゲン、C 1 ~ C 5 アルキル、C 1 ~ C 5 ハロアルキル、ヒドロキシル、C 1 ~ C 5 アルコキシ、ニトロ、シアノ、C 1 ~ C 5 アルコシカルボニル、C 1 ~ C 5 アルキルカルボニルまたは C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ、アミノ、C 1 ~ C 5 アルキルアミノ、および C 1 ~ C 5 ジアルキルアミノからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるピロリジニル、アゼチジニル、ピペリジニル、ピペラジニルまたはモルホリニル基である、請求項 2 に記載の化合物。

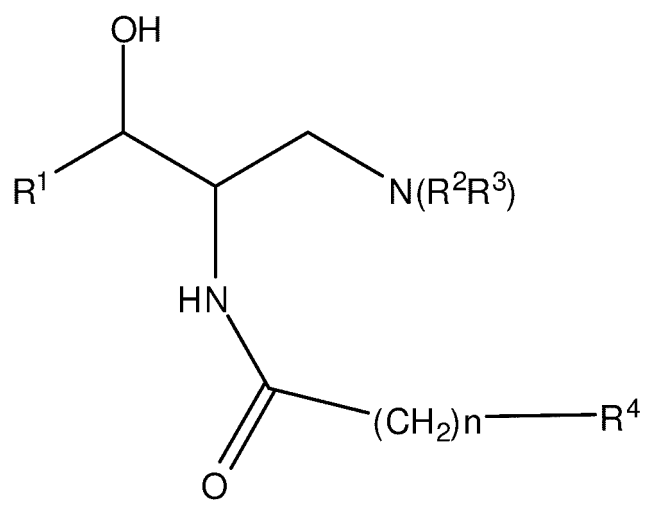
【請求項 4】

R^4 が、ハロゲン、C 1 ~ C 10 アルキル、C 1 ~ C 10 ハロアルキル、 Ar^3 、 $-OR^{5\ 0}$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^{5\ 0}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-NR^{5\ 1}C(O)R^{5\ 0}$ 、 $-C(O)R^{5\ 0}$ 、 $-C(O)OR^{5\ 0}$ 、 $-OC(O)R^{5\ 0}$ 、 $-C(O)N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-V_4-Ar^3$ 、 $-V_4-OR^{5\ 0}$ 、 $-V_4-O$ (ハロアルキル)、 $-V_4-SR^{5\ 0}$ 、 $-V_4-NO_2$ 、 $-V_4-CN$ 、 $-V_4-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-V_4-NR^{5\ 1}C(O)R^{5\ 0}$ 、 $-V_4-C(O)R^{5\ 0}$ 、 $-V_4-CO_2R^{5\ 0}$ 、 $-V_4-OC(O)R^{5\ 0}$ 、 $-V_4-C(O)N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-V_5-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-S-V_4-Ar^3$ 、 $-S-V_5-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-N(R^{5\ 1})-V_4-Ar^3$ 、 $-N(R^{5\ 1})-V_5-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-NR^{5\ 1}C(O)-V_4-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-NR^{5\ 1}C(O)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)-V_4-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-C(O)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)O-V_5-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-C(O)O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-C(O)-V_5-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-O-C(O)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)N(R^{5\ 1})-V_5-N(R^{5\ 1})_2$ 、 $-C(O)N(R^{5\ 1})-V_4-Ar^3$ 、 $-O-[CH_2]_p$ 、 $-O$ および $-[CH_2]_q$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で、各々が任意におよび独立して置換されるアリール基である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

以下の構造式：

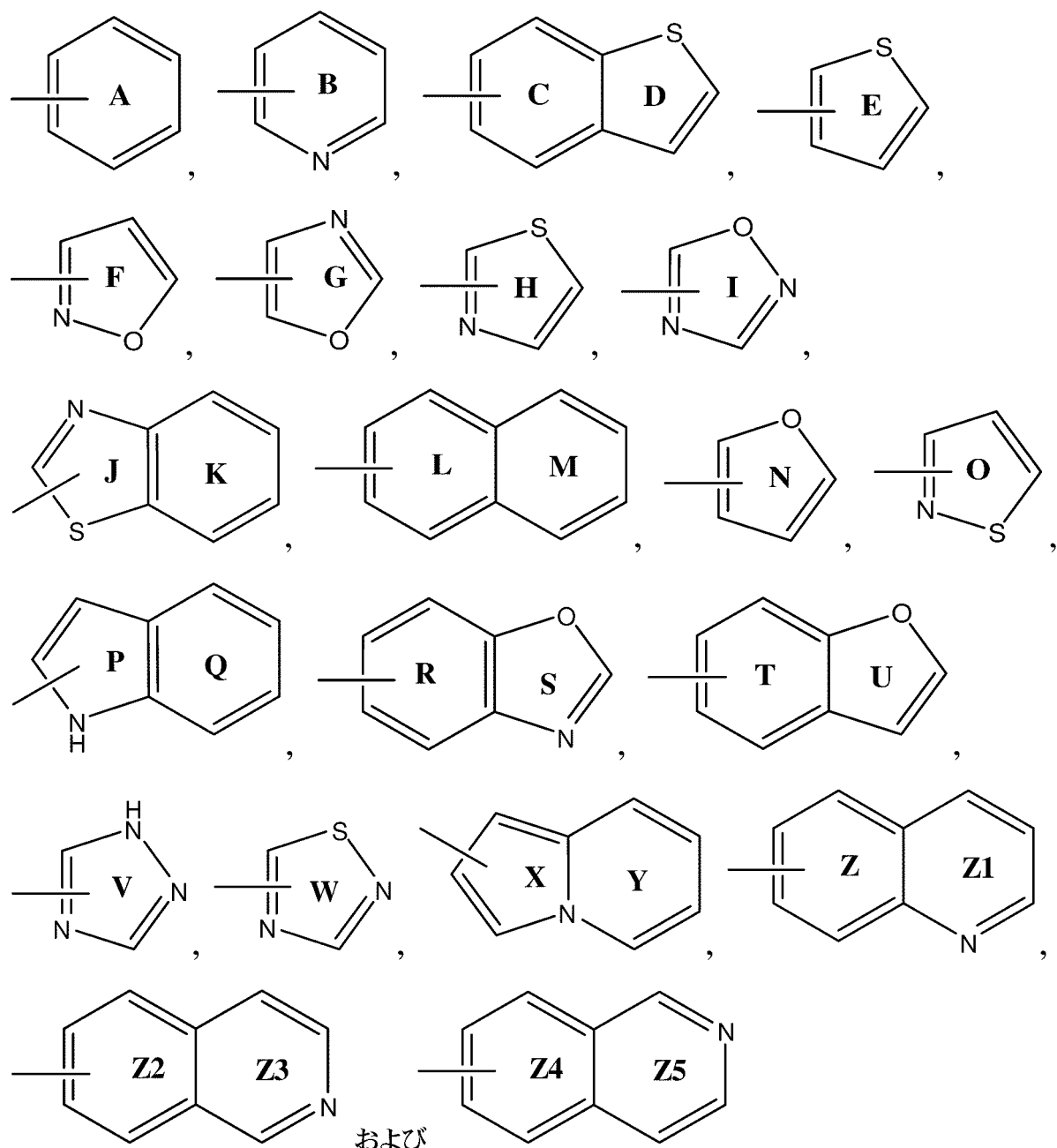
【化 2】



によって表される、請求項 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

R^4 が：
【化 3】



(式中：

環 A ~ Z 5 の各々は、任意におよび独立して置換される)
からなる群から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

- N ($R^2 R^3$) が、非置換のピロリジニル、アゼチジニル、ピペリジニル、ピペラジニルまたはモルホリニル基である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^4 が、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、 Ar^3 、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 1 ~ C 6 アルコキシ、ヒドロキシおよび C 1 ~ C 6 ハロアルコキシからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるビアリール基である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

任意に置換されるビアリール基が、任意に置換されるビフェニル基である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

$-N(R^2 R^3)$ がピロリジニルであり；ならびに
 R^1 が、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OC_2H_5$ および $-O-[CH_2]_p-O-$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるフェニル基である
 請求項 9 に記載の化合物。

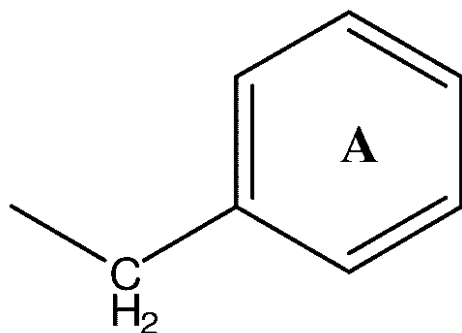
【請求項 11】

n が、1、2、3 または 4 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

$-(CH_2)_n-R^4$ が

【化 4】



であり、式中、フェニル環 A が、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、 Ar^3 、C1～C6 アルキル、C1～C6 ハロアルキル、C1～C6 アルコキシ、ヒドロキシおよび C1～C6 ハロアルコキシからなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 13】

$-N(R^2 R^3)$ がピロリジニルであり；ならびに
 R^1 が、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OC_2H_5$ および $-O-[CH_2]_p-O-$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されるフェニル基である
 請求項 12 に記載の化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0036

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0036】

低級アルキル、アリールアルキルおよび環 A～Z5 を含む、 R^4 により表される脂肪族基およびアリール基の各々に対する好ましい置換基としては、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、 Ar^3 、 Ar^3-Ar^3 、 $-OR^{50}$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^{50}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NCS$ 、 $-N(R^{51})_2$ 、 $-NR^{51}C(O)R^{50}$ 、 $-NR^{51}C(O)OR^{52}$ 、 $-N(R^{51})C(O)N(R^{51})_2$ 、 $-C(O)R^{50}$ 、 $-C(S)R^{50}$ 、 $-C(O)OR^{50}$ 、 $-OC(O)R^{50}$ 、 $-C(O)N(R^{51})_2$ 、 $-S(O)_2R^{50}$ 、 $-SO_2N(R^{51})_2$ 、 $-S(O)R^{52}$ 、 $-SO_3R^{50}$ 、 $-NR^{51}SO_2N(R^{51})_2$ 、 $-NR^{51}SO_2R^{52}$ 、 $-V_4-Ar^3$ 、 $-V_4-O$ 、 $-V_4-R^{50}$ 、 $-V_4-O$ (ハロアルキル)、 $-V_4-SR^{50}$ 、 $-V_4-NO_2$ 、 $-V_4-C$

N 、 $-V_4-N(R^{51})_2$ 、 $-V_4-NR^{51}C(O)R^{50}$ 、 $-V_4-NR^{51}CO$
 $_2R^{52}$ 、 $-V_4-N(R^{51})C(O)N(R^{51})_2$ 、 $-V_4-C(O)R^{50}$ 、 $-$
 $V_4-C(S)R^{50}$ 、 $-V_4-CO_2R^{50}$ 、 $-V_4-OC(O)R^{50}$ 、 $-V_4-C$
 $(O)N(R^{51})_2$ 、 $-V_4-S(O)_2R^{50}$ 、 $-V_4-SO_2N(R^{51})_2$ 、
 $-V_4-S(O)R^{52}$ 、 $-V_4-SO_3R^{50}$ 、 $-V_4-NR^{51}SO_2N(R^{51})$
 $_2$ 、 $-V_4-NR^{51}SO_2R^{52}$ 、 $-O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-V_5-N(R^{51})_2$
 $-S-V_4-Ar^3$ 、 $-S-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-N(R^{51})-V_4-Ar^3$ 、
 $-N(R^{51})-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-NR^{51}C(O)-V_4-N(R^{51})_2$ 、
 $-NR^{51}C(O)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)-V_4-N(R^{51})_2$ 、 $-C(O)-$
 V_4-Ar^3 、 $-C(S)-V_4-N(R^{51})_2$ 、 $-C(S)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)O-V_5-N(R^{51})_2$ 、
 $-C(O)O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-C(O)-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-O-C(O)-V_4-Ar^3$ 、
 $-C(O)N(R^{51})-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-C(O)N(R^{51})-V_4-Ar^3$ 、 $-S(O)_2-V_4-N(R^{51})$
 $_2$ 、 $-S(O)_2-V_4-Ar^3$ 、 $-SO_2N(R^{51})-V_5-N(R^{51})_2$ 、
 $-SO_2N(R^{51})-V_4-Ar^3$ 、 $-S(O)-V_4-N(R^{51})_2$ 、 $-S(O)-$
 V_4-Ar^3 、 $-S(O)_2-O-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-S(O)_2-O-V_4-Ar^3$ 、
 $-NR^{51}SO_2-V_4-N(R^{51})_2$ 、 $-NR^{51}SO_2-V_4-Ar^3$ 、
 $O-[CH_2]_p$ 、 $-O-$ 、 $-S-[CH_2]_p$ 、 $-S-$ 、および $-[CH_2]_q$ 、 $-$ が
 挙げられる。より好ましくは、低級アルキル、アリールアルキルおよび環A～Z5を含む
 R^4 により表される脂肪族基およびアリール基の各々に対する置換基としては、ハロゲン、
 $C1\sim C10$ アルキル、 $C1\sim C10$ ハロアルキル、 Ar^3 、 Ar^3-Ar^3 、 $-OR^{50}$ 、
 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^{50}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^{51})_2$ 、
 $-NR^{51}C(O)R^{50}$ 、 $-C(O)R^{50}$ 、 $-C(O)OR^{50}$ 、 $-OC(O)R^{50}$ 、
 $-C(O)N(R^{51})_2$ 、 $-V_4-Ar^3$ 、 $-V_4-OR^{50}$ 、 $-V_4-O$ (ハロアル
 キル)、 $-V_4-SR^{50}$ 、 $-V_4-NO_2$ 、 $-V_4-CN$ 、 $-V_4-N(R^{51})_2$ 、
 $-V_4-NR^{51}C(O)R^{50}$ 、 $-V_4-C(O)R^{50}$ 、 $-V_4-CO_2R^{50}$ 、
 $-V_4-OC(O)R^{50}$ 、 $-V_4-C(O)N(R^{51})_2$ 、 $-O-V_4-Ar^3$ 、
 $-O-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-S-V_4-Ar^3$ 、 $-S-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-N$
 $(R^{51})-V_4-Ar^3$ 、 $-N(R^{51})-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-NR^{51}C(O)$
 $-V_4-N(R^{51})_2$ 、 $-NR^{51}C(O)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)-V_4-N$
 $(R^{51})_2$ 、 $-C(O)-V_4-Ar^3$ 、 $-C(O)O-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-C$
 $(O)O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-C(O)-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-O-C(O)-V$
 $_4-Ar^3$ 、 $-C(O)N(R^{51})-V_5-N(R^{51})_2$ 、 $-C(O)N(R^{51})$
 $-V_4-Ar^3$ 、 $-O-[CH_2]_p$ 、 $-O-$ および $-[CH_2]_q$ 、 $-$ が挙げられる。
 より好ましくは、低級アルキル、アリールアルキルおよび環A～Z5を含む、 R^4 により
 表される脂肪族基およびアリール基の各々に対する置換基としては、ハロゲン、シアノ、
 ニトロ、 $C1\sim C10$ アルキル、 $C1\sim C10$ ハロアルキル、アミノ、 $C1\sim C10$ アル
 キルアミノ、 $C1\sim C10$ ジアルキルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヒドロキシ、
 $C1\sim 10$ アルコキシ、 $-O-[CH_2]_p$ 、 $-O-$ または $-[CH_2]_q$ 、 $-$ が挙げられる。
 さらにより好ましくは、低級アルキル、アリールアルキルおよび環A～Z5を含む、 R^4 により
 表される脂肪族基およびアリール基の各々に対する置換基としては、ハロゲン、
 シアノ、アミノ、ニトロ、 Ar^3 、 $C1\sim C6$ アルキル、 $C1\sim C6$ ハロアルキル、 $C1$
 $\sim C6$ アルコキシ、ヒドロキシおよび $C1\sim C6$ ハロアルコキシが挙げられる。さらにより
 好ましくは、低級アルキル、アリールアルキルおよび環A～Z5を含む、 R^4 により表
 される脂肪族およびアリール基の各々に対する置換基としては、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、
 $-OC_2H_5$ および $-O-[CH_2]_p$ 、 $-O-$ が挙げられる。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

好ましくは、フェニル環 A は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C 1 ~ C 10 アルキル、C 1 ~ C 10 ハロアルキル、アミノ、C 1 ~ C 10 アルキルアミノ、C 1 ~ C 10 ジアルキルアミノ、 $-OR^{50}$ 、 $-Ar^3$ 、 $-V_4-Ar^3$ 、 $-V_4-OR^{50}$ 、 $-O(C1 \sim C10 \text{ ハロアルキル})$ 、 $-V_4-O(C1 \sim C10 \text{ ハロアルキル})$ 、 $-O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-[CH_2]_p-O$ および $-[CH_2]_q-$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意により置換されている。より好ましくは、フェニル環 A は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C 1 ~ C 10 アルキル、C 1 ~ C 10 ハロアルキル、アミノ、C 1 ~ C 10 アルキルアミノ、C 1 ~ C 10 ジアルキルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヒドロキシ、C 1 ~ 10 アルコキシ、 $-O-[CH_2]_p-O$ および $-[CH_2]_q-$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意により置換されている。さらにより好ましくは、フェニル環 A は、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ および $-OC_2H_5$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意により置換されている。具体的には、 R^4 がフェニル環 A である場合、環 A の置換基の少なくとも 1 個はパラ位にある。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0130

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0130】

フェニル環 A は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C 1 ~ C 10 アルキル、C 1 ~ C 10 ハロアルキル、アミノ、C 1 ~ C 10 アルキルアミノ、C 1 ~ C 10 ジアルキルアミノ、 $-OR^{50}$ 、 $-Ar^3$ 、 $-V_4-Ar^3$ 、 $-V_4-OR^{50}$ 、 $-O(C1 \sim C10 \text{ ハロアルキル})$ 、 $-V_4-O(C1 \sim C10 \text{ ハロアルキル})$ 、 $-O-V_4-Ar^3$ 、 $-O-[CH_2]_p$ 、 $-O$ および $-[CH_2]_q$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基で任意により置換されている。