

【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18年1月12日(2006.1.12)

【公表番号】特表2005-528325(P2005-528325A)

【公表日】平成17年9月22日(2005.9.22)

【年通号数】公開・登録公報2005-037

【出願番号】特願2003-530682(P2003-530682)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 401/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4439 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/444 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4545 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/506 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**

**A 6 1 P 5/38 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 13/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 15/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 31/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 401/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 405/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 409/14 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 5/38

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 409/14

【手続補正書】

【提出日】平成17年9月21日(2005.9.21)

【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

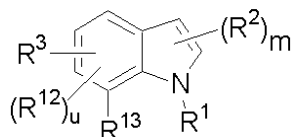
【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

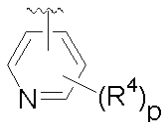
## 【請求項 1】

式

## 【化 1】

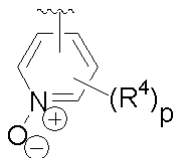
式中、 $R^1$  は、

## 【化 2】



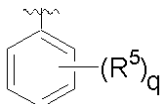
〔式中、 $R^4$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 3】



〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

## 【化 4】

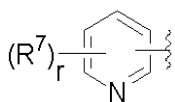


〔式中、 $R^5$  は、CN、ハロゲン、CHO または  $C(O)N(R^6)_2$  (式中、 $R^6$  は H または  $C_1 \sim 4$  アルキルを表す) を表し；そして、 $q$  は 0、1 または 2 である〕

を表し；

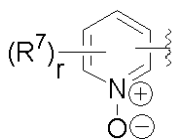
 $R^2$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルを表し；そして、 $m$  は 0、1 または 2 であり； $R^3$  は、

## 【化 5】



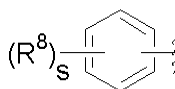
〔式中、 $R^7$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルまたは CN であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 6】



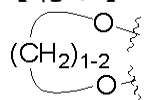
〔但し、 $R^1$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；

## 【化 7】



〔式中、 $R^8$  は、 $CN$ 、ハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_{1-4}$  アシル、 $CO_2R^9$ （式中、 $R^9$  は $H$ または $C_{1-4}$  アルキルである）、または

【化 8】



を表し；そして、

$s$  は 0、1 または 2 である 〕；

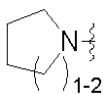
【化 9】



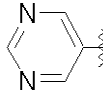
【化 10】



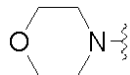
【化 11】



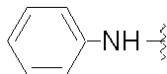
【化 12】



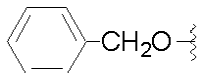
【化 13】



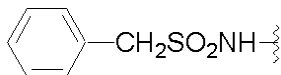
【化 14】



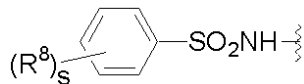
【化 15】



【化 16】



【化 17】

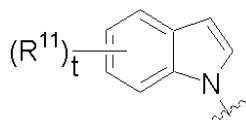


$C_{1-4}$  アルキル -  $SO_2NH$  - ；

$CN$  ；

$N(R^{10})_2$ （式中、 $R^{10}$  は $C_{1-4}$  アルキルである）；または

## 【化 1 8】



〔式中、 $R^{11}$  はハロゲンであり；そして、

$t$  は 0、1 または 2 である〕；

を表し；

$R^{12}$  は、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、ハロゲンまたは  $CN$  (但し、 $R^3$  はシアノ以外である) を表し；そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり；

$R^{13}$  は  $H$  または  $R^{12}$  を表し；そして、

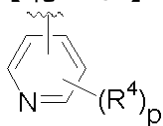
$R^1$  および  $R^3$  の一方は、2 および 6 位で非置換の、3 - ピリジルまたは 3 - ピリジル -  $N$  - オキシド基である；

の化合物、またはそれらの医薬的に許容し得る塩。

## 【請求項 2】

式中、 $R^1$  が、

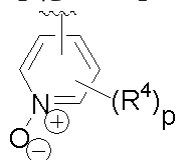
## 【化 1 9】



〔式中、 $R^4$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、

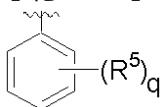
$p$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 2 0】



〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは  $N$  - オキシド - 含有基以外である〕；または

## 【化 2 1】



〔式中、 $R^5$  は、 $CN$ 、ハロゲン、 $CHO$  または  $C(O)N(R^6)_2$  (式中、 $R^6$  は  $H$  または  $C_1 - 4$  アルキルを表す) を表し；そして、

$q$  は 0、1 または 2 である〕；

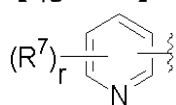
を表し；

$R^2$  が  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、

$m$  が 0、1 または 2 であり、

$R^3$  が、

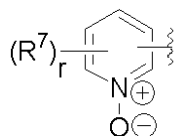
## 【化 2 2】



〔式中、 $R^7$  は  $C_1 - 4$  アルキルまたは  $CN$  であり；そして、

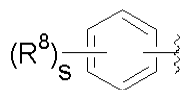
$r$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 2 3】



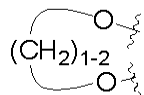
〔但し、 $R^1$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；

## 【化 2 4】



〔式中、 $R^8$  は、CN、ハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_{1-4}$  アシル、 $CO_2R^9$ （式中  $R^9$  は H または  $C_{1-4}$  アルキルである）、または

## 【化 2 5】



を表し；そして、

$s$  は 0、1 または 2 である〕；

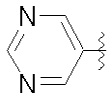
## 【化 2 6】



## 【化 2 7】

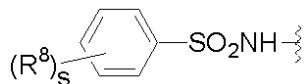


## 【化 2 8】



または

## 【化 2 9】

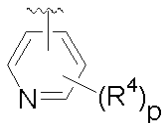


を表す、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

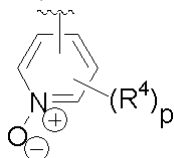
式中、 $R^1$  が、

## 【化 3 0】



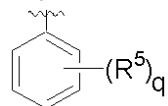
〔式中、 $R^4$  は  $C_{1-4}$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 3 1】



〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

## 【化 3 2】



〔式中、 $R^5$  は、CN、ハロゲン、CHO または  $C(O)N(R^6)_2$  (式中、 $R^6$  は H または  $C_{1-4}$  アルキルを表す) を表し；そして、 $q$  は 0、1 または 2 である〕、

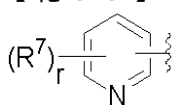
を表し、

$R^2$  が  $C_{1-4}$  アルキルを表し；そして、

$m$  が 0、1 または 2 であり；そして、

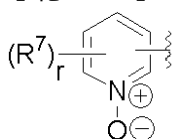
$R^3$  が、

## 【化 3 3】



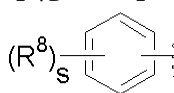
〔式中、 $R^7$  は  $C_{1-4}$  アルキルまたは CN であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 3 4】



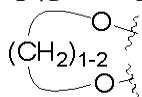
〔但し、 $R^1$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；

## 【化 3 5】



〔式中、 $R^8$  は、CN、ハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_{1-4}$  アシル、 $CO_2R^9$  (式中、 $R^9$  は H または  $C_{1-4}$  アルキルである)、または

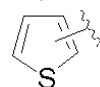
## 【化 3 6】



を表し；そして、

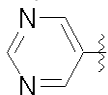
$s$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 3 7】



または

## 【化 3 8】

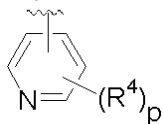


を表す、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

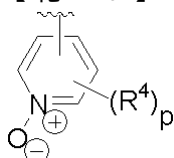
式中、 $R^1$  が、

## 【化 3 9】



〔式中、 $R^4$  は  $C_{1-4}$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；または

## 【化 4 0】



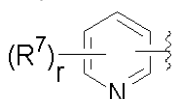
〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；  
を表し、

$R^2$  が  $C_{1-4}$  アルキルを表し；そして、

$m$  が 0、1 または 2 であり；そして、

$R^3$  が、

## 【化 4 1】



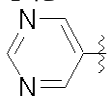
〔式中、 $R^7$  は  $C_{1-4}$  アルキルまたは CN であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 4 2】



または

## 【化 4 3】



を表す、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物および医薬的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

## 【請求項 6】

リアーゼ酵素を請求項 1 に記載の化合物と接触させることを含む、リアーゼ酵素の阻害方法。

## 【請求項 7】

17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 リアーゼを請求項 1 に記載の化合物と接触させることを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 リアーゼの阻害方法。

## 【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 リアーゼに関連する癌を有する対象の処置方法。

【請求項 9】

対象中の前立腺癌が処置されるように請求項 1 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の前立腺癌の処置方法。

【請求項 10】

対象中の乳癌が処置されるように請求項 1 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の乳癌の処置方法。

【請求項 11】

該対象が、霊長類、ウマ科、イヌ科またはネコ科である、請求項 8 ないし請求項 10 のいずれかに記載の方法。

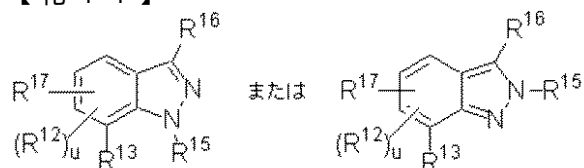
【請求項 12】

該対象がヒトである、請求項 8 ないし請求項 10 のいずれかに記載の方法。

【請求項 13】

式

【化 4 4】

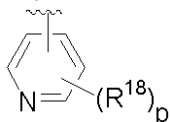


式中、 $R^{1,2}$  は、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、ハロゲンまたは CN を表し；  
そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり；

$R^{1,3}$  は H または  $R^{1,2}$  を表し；

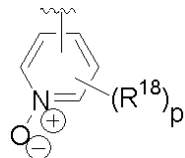
$R^{1,5}$  は、

【化 4 5】



〔式中、 $R^{1,8}$  は  $C_{1-4}$  アルキルを表し；そして  $p$  は 0、1 または 2 である〕；または

【化 4 6】

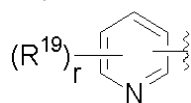


〔但し、 $R^{1,7}$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；  
を表し、

$R^{1,6}$  は H または  $C_{1-4}$  アルキルを表し；そして、

$R^{1,7}$  は、

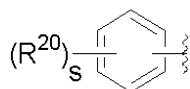
【化 4 7】



〔式中、 $R^{1,9}$  は  $C_{1-4}$  アルキルであり；そして、  
 $r$  は 0、1 または 2 である〕；または



## 【化 4 8】



〔式中、 $R^{20}$  は、ハロゲン、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$  または  $CO_2 R^{21}$  (式中、 $R^{21}$  は H または  $C_1 - 4$  アルキルである) を表し；そして、

$s$  は 0、1 または 2 である〕；

を表し；そして、

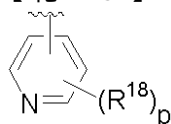
$R^{15}$  および  $R^{17}$  の一方は、2 および 6 位で非置換の、3 - ピリジルまたは 3 - ピリジル - N - オキシド基である、

の化合物、またはそれらの医薬的に許容し得る塩。

## 【請求項 1 4】

式中、 $R^{15}$  が、

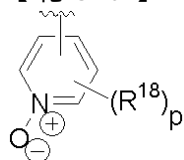
## 【化 4 9】



〔式中、 $R^{18}$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、

$p$  は 0、1 または 2 である〕；または

## 【化 5 0】



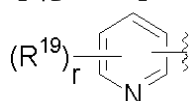
〔但し、 $R^{17}$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；

を表し、

$R^{16}$  が H を表し；そして

$R^{17}$  が、

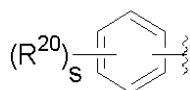
## 【化 5 1】



〔式中、 $R^{19}$  は  $C_1 - 4$  アルキルであり；そして、

$r$  は 0、1 または 2 である〕；または

## 【化 5 2】



〔式中、 $R^{20}$  は、ハロゲン、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$  または  $CO_2 R^{21}$  (式中、 $R^{21}$  は H または  $C_1 - 4$  アルキルである) を表し；そして、

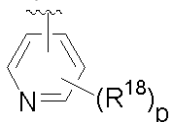
$s$  は 0、1 または 2 である〕；

を表す、請求項 1 3 に記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

式中、 $R^{15}$  が、

## 【化 5 3】



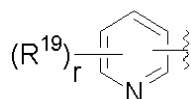
〔式中、 $R^{18}$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；

を表し、

$R^{16}$  が H を表し；そして、

$R^{17}$  が、

## 【化 5 4】



〔式中、 $R^{19}$  は  $C_1 - 4$  アルキルであり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

を表す、請求項 13 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

請求項 13 に記載の化合物および医薬的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

## 【請求項 17】

リアーゼ酵素を請求項 13 に記載の化合物と接触させることを含む、リアーゼ酵素の阻害方法。

## 【請求項 18】

17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 リアーゼを請求項 13 に記載の化合物と接触させることを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 リアーゼの阻害方法。

## 【請求項 19】

請求項 13 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 リアーゼに関連する癌を有する対象の処置方法。

## 【請求項 20】

対象中の前立腺癌が処置されるように請求項 13 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の前立腺癌の処置方法。

## 【請求項 21】

対象中の乳癌が処置されるように請求項 13 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の乳癌の処置方法。

## 【請求項 22】

該対象が、霊長類、ウマ科、イヌ科またはネコ科である、請求項 19 ないし請求項 21 のいずれかに記載の方法。

## 【請求項 23】

該対象がヒトである、請求項 19 ないし請求項 21 のいずれかに記載の方法。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

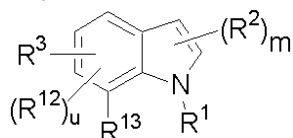
【補正の内容】

【0008】

発明の概要

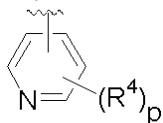
本発明は、例えば 17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 - リアーゼなどの酵素のリアーゼ活性を阻害する置換 3 - ピリジルインドールおよびインダゾール化合物を提供する。本発明のインドール化合物は、式

## 【化 1】



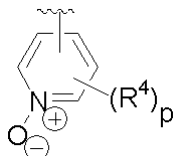
式中、 $R^1$  は、

## 【化 2】



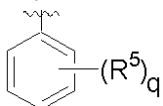
〔式中、 $R^4$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 3】



〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

## 【化 4】



〔式中、 $R^5$  は、CN、ハロゲン、CHO または  $C(O)N(R^6)_2$  (式中、 $R^6$  は H または  $C_1 \sim 4$  アルキルを表す) を表し；そして、 $q$  は 0、1 または 2 である〕、  
を表し、

## 【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0009

【補正方法】変更

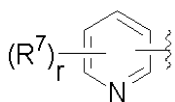
【補正の内容】

【0009】

$R^2$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルを表し；そして、 $m$  は 0、1 または 2 であり、

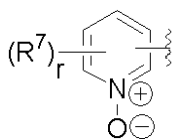
$R^3$  は、

## 【化 5】



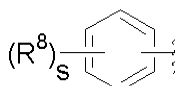
〔式中、 $R^7$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルまたは CN であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 6】



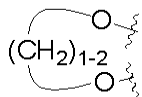
〔但し、 $R^1$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；

## 【化 7】



〔式中、 $R^8$  は、 $CN$ 、ハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_{1-4}$  アシル、 $CO_2R^9$ （式中、 $R^9$  は  $H$  または  $C_{1-4}$  アルキルである）、または

【化 8】



を表し；そして、

$s$  は 0、1 または 2 である 〕；

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

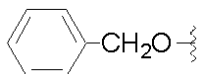
【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

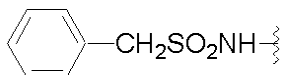
【補正の内容】

【0011】

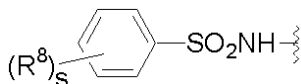
【化 15】



【化 16】



【化 17】

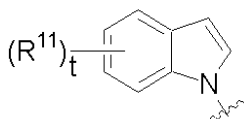


$C_{1-4}$  アルキル -  $SO_2NH$  - ；

$CN$  ；

$N(R^{10})_2$ （式中、 $R^{10}$  は  $C_{1-4}$  アルキルである）；または

【化 18】



〔式中、 $R^{11}$  はハロゲンであり；そして、 $t$  は 0、1 または 2 である 〕；

を表し、

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

$R^{12}$  は、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、ハロゲンまたは  $CN$ （但し、 $R^3$  はシアノ以外である）を表し；そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり、

$R^{13}$  は  $H$  または  $R^{12}$  を表す、

を有する。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

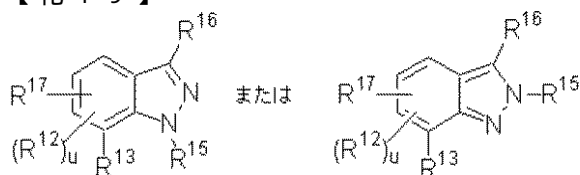
## 【補正方法】変更

## 【補正の内容】

【0014】

本発明のインダゾール化合物は、式

## 【化19】

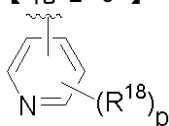


式中、 $R^{12}$  は、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、ハロゲンまたは  $CN$  を表し；  
 そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり、

$R^{13}$  は  $H$  または  $R^{12}$  を表し、

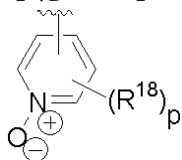
$R^{15}$  は、

## 【化20】



〔式中、 $R^{18}$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして  $p$  は 0、1 または 2 である〕；または

## 【化21】



〔但し、 $R^{17}$  はピリジルまたは  $N$  - オキシド - 含有基以外である〕、  
 を表し、

## 【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

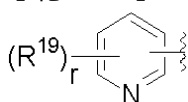
【補正の内容】

【0015】

$R^{16}$  は  $H$  または  $C_1 - 4$  アルキルを表し、

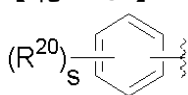
$R^{17}$  は、

## 【化22】



〔式中、 $R^{19}$  は  $C_1 - 4$  アルキルであり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；または

## 【化23】



〔式中、 $R^{20}$  は、ハロゲン、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$  または  $CO_2R^{21}$  (式中、 $R^{21}$  は  $H$  または  $C_1 - 4$  アルキルである) を表し；そして、 $s$  は 0、1 または 2 である〕、  
 を表す、

を有する。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

【補正方法】変更

【補正の内容】

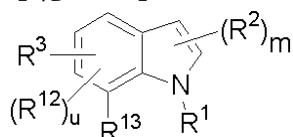
【0021】

発明の詳細な説明

本発明は、少なくとも部分的に、置換 3 - ピリジルインドールおよびインダゾール化合物が酵素 17 - ヒドロキシラーゼ - C 17, 20 - リアーゼを阻害するという発見に基づく。

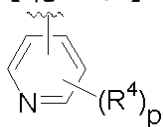
好ましい実施態様では、本発明のインドール化合物は、式

【化 2 4】



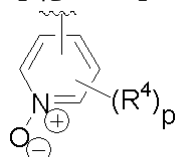
式中、R¹ は、

【化 2 5】



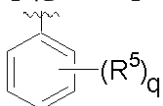
〔式中、R⁴ は C₁ - ₄ アルキルを表し；そして、p は 0、1 または 2 である〕；

【化 2 6】



〔但し、R³ はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

【化 2 7】



〔式中、R⁵ は、CN、ハロゲン、CHO または C(O)N(R⁶)₂ (式中、R⁶ は H または C₁ - ₄ アルキルを表す) を表し；そして、q は 0、1 または 2 である〕、

を表し、

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

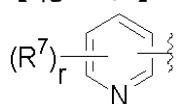
【補正の内容】

【0022】

R² は C₁ - ₄ アルキルを表し；そして、m は 0、1 または 2 であり、

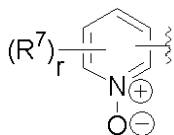
R³ は、

【化 2 8】



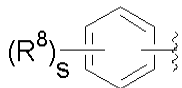
〔式中、 $R^7$  は  $C_1 - 4$  アルキルまたは  $CN$  であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

【化 2 9】



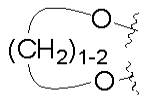
〔但し、 $R^1$  はピリジルまたは  $N$  - オキシド - 含有基以外である〕；

【化 3 0】



〔式中、 $R^8$  は、 $CN$ 、ハロゲン、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_1 - 4$  アシル、 $CO_2R^9$ （式中  $R^9$  は  $H$  または  $C_1 - 4$  アルキルである）、または

【化 3 1】



を表し；そして、

$s$  は 0、1 または 2 である〕；

【手続補正 1 0】

【補正対象書類名】明細書

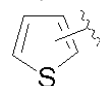
【補正対象項目名】0 0 2 3

【補正方法】変更

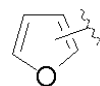
【補正の内容】

【0 0 2 3】

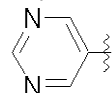
【化 3 2】



【化 3 3】

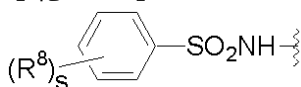


【化 3 4】



または

【化 3 5】



を表し、

$R^{12}$  は、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、ハロゲンまたは  $CN$ （但し、 $R^3$  はシアノ以外である）を表し；そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり、

$R^{13}$  は  $H$  または  $R^{12}$  を表す、

を有する。

【手続補正 1 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0025

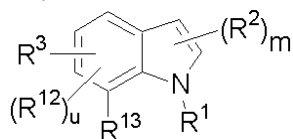
【補正方法】変更

【補正の内容】

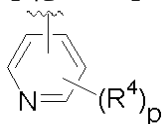
【0025】

より好ましい実施態様では、本発明のインドール化合物は、式

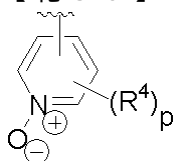
【化36】

式中、 $R^1$  は、

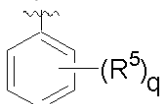
【化37】

〔式中、 $R^4$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；

【化38】

〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

【化39】

〔式中、 $R^5$  は、 $CN$ 、ハロゲン、 $CHO$  または  $C(O)N(R^6)_2$  (式中、 $R^6$  は  $H$  または  $C_1 - 4$  アルキルを表す) を表し；そして、 $q$  は 0、1 または 2 である〕、を表し、

【手続補正12】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0026

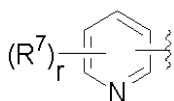
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0026】

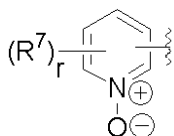
 $R^2$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、 $m$  は 0、1 または 2 であり、 $R^3$  は、

【化40】

〔式中、 $R^7$  は  $C_1 - 4$  アルキルまたは  $CN$  であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

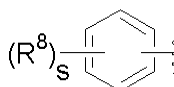


## 【化 4 1】



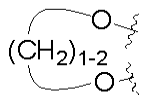
〔但し、 $R^1$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；

## 【化 4 2】



〔式中、 $R^8$  は、CN、ハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $C_{1-4}$  アシル、 $CO_2 R^9$ （式中、 $R^9$  は H または  $C_{1-4}$  アルキルである）、または

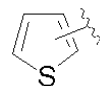
## 【化 4 3】



を表し；そして

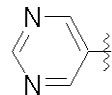
$s$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 4 4】



または

## 【化 4 5】



を表し、

$R^{12}$  は、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、ハロゲンまたは CN（但し、 $R^3$  はシアノ以外である）を表し；そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり、

$R^{13}$  は H または  $R^{12}$  を表す、

を有する。

## 【手続補正 13】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0028

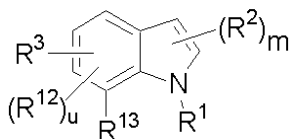
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0028】

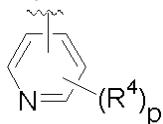
最も好ましい実施態様では、本発明のインドール化合物は、式

## 【化 4 6】



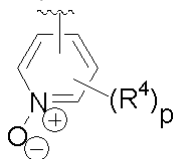
式中、 $R^1$  は、

## 【化 4 7】



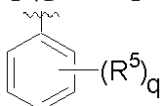
〔式中、 $R^4$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 4 8】



〔但し、 $R^3$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

## 【化 4 9】



〔式中、 $R^5$  は、 $CN$ 、ハロゲン、 $CHO$  または  $C(O)N(R^6)_2$  (式中、 $R^6$  は  $H$  または  $C_1 \sim 4$  アルキルを表す) を表し；そして、 $q$  は 0、1 または 2 である〕、

## 【手続補正 1 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 9

【補正方法】変更

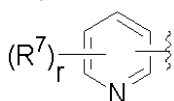
【補正の内容】

【0 0 2 9】

$R^2$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルを表し；そして、 $m$  は 0、1 または 2 であり、

$R^3$  は、

## 【化 5 0】



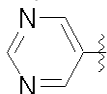
〔式中、 $R^7$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルまたは  $CN$  であり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；

## 【化 5 1】



または

## 【化 5 2】



を表し、

$R^{1,2}$  は、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、ハロゲンまたは  $CN$  (但し、 $R^3$  はシアノ以外である) を表し；そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり、

$R^{1,3}$  は  $H$  または  $R^{1,2}$  を表す、

を有する。

## 【手続補正 1 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 3 1

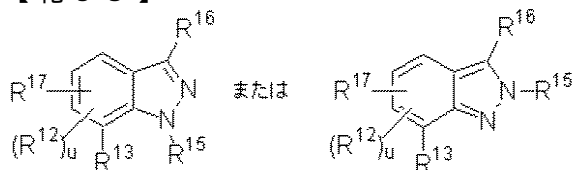
【補正方法】 変更

【補正の内容】

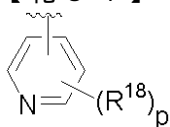
【 0 0 3 1 】

好ましい実施態様では、本発明のインダゾール化合物は、式

【化 5 3 】

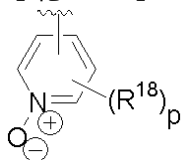
式中、 $R^{12}$  は、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、ハロゲンまたは CN を表し；そして、 $u$  は 0、1 または 2 であり、 $R^{13}$  は H または  $R^{12}$  を表し、 $R^{15}$  は、

【化 5 4 】



〔式中、 $R^{18}$  は  $C_1 - 4$  アルキルを表し；そして、 $p$  は 0、1 または 2 である〕；または

【化 5 5 】

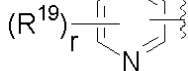


〔但し、 $R^{17}$  はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕、

を表し、

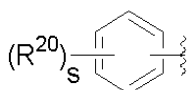
 $R^{16}$  は H を表し、 $R^{17}$  は、

【化 5 6 】



〔式中、 $R^{19}$  は  $C_1 - 4$  アルキルであり；そして、 $r$  は 0、1 または 2 である〕；または

【化 5 7 】



〔式中、 $R^{20}$  は、ハロゲン、 $C_1 - 4$  アルキル、 $C_1 - 4$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $CF_3$  または  $CO_2 R^{21}$  (式中、 $R^{21}$  は H または  $C_1 - 4$  アルキルである) を表し；そして、 $s$  は 0、1 または 2 である〕、

を表す、

を有する。

【手続補正 16】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 0 0 3 3

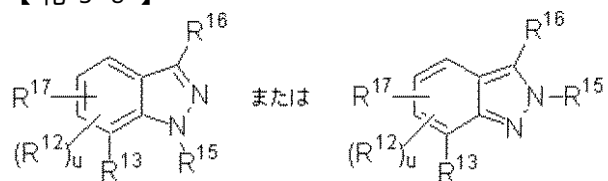
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0033】

より好ましい実施態様では、本発明のインダゾール化合物は、式

【化58】



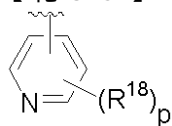
式中、

R<sup>1 2</sup> は、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、C<sub>1</sub> - 4 アルコキシ、ハロゲンまたはCNを表し；そして、  
u は0、1または2であり、

R<sup>1 3</sup> はHまたはR<sup>1 2</sup>を表し、

R<sup>1 5</sup> は、

【化59】

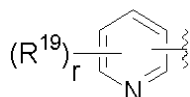


〔式中、R<sup>1 8</sup> はC<sub>1</sub> - 4 アルキルを表し；そして、p は0、1または2である〕、  
を表し、

R<sup>1 6</sup> はHを表し、

R<sup>1 7</sup> は、

【化60】



〔式中、R<sup>1 9</sup> はC<sub>1</sub> - 4 アルキルであり；そしてr は0、1または2である〕、  
を表す、  
を有する。