

【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19年5月10日(2007.5.10)

【公開番号】特開2006-328073(P2006-328073A)

【公開日】平成18年12月7日(2006.12.7)

【年通号数】公開・登録公報2006-048

【出願番号】特願2006-157094(P2006-157094)

【国際特許分類】

C 07 C 35/42 (2006.01)  
C 07 C 255/53 (2006.01)  
A 61 K 31/122 (2006.01)  
A 61 K 31/06 (2006.01)  
A 61 K 31/11 (2006.01)  
C 07 D 295/08 (2006.01)  
A 61 K 31/5375 (2006.01)  
A 61 K 31/215 (2006.01)  
A 61 K 31/275 (2006.01)  
C 07 D 213/30 (2006.01)  
A 61 K 31/4402 (2006.01)  
A 61 K 31/19 (2006.01)  
A 61 K 31/047 (2006.01)  
A 61 K 31/255 (2006.01)  
A 61 K 31/045 (2006.01)  
A 61 K 31/137 (2006.01)  
C 07 D 257/04 (2006.01)  
A 61 K 31/41 (2006.01)  
A 61 K 31/166 (2006.01)  
A 61 K 31/27 (2006.01)  
A 61 K 31/136 (2006.01)  
C 07 D 317/38 (2006.01)  
A 61 K 31/357 (2006.01)  
A 61 K 31/4453 (2006.01)  
A 61 K 31/15 (2006.01)  
A 61 K 31/192 (2006.01)  
A 61 K 31/40 (2006.01)  
C 07 D 471/04 (2006.01)  
A 61 K 31/4375 (2006.01)  
C 07 D 249/08 (2006.01)  
A 61 K 31/4196 (2006.01)  
C 07 D 295/18 (2006.01)  
A 61 K 31/495 (2006.01)  
A 61 K 31/133 (2006.01)  
C 07 D 413/04 (2006.01)  
A 61 K 31/496 (2006.01)  
C 07 D 271/06 (2006.01)  
A 61 K 31/4245 (2006.01)  
C 07 D 241/18 (2006.01)  
A 61 K 31/4965 (2006.01)  
C 07 D 239/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4406 (2006.01)  
 C 0 7 D 303/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/336 (2006.01)  
 C 0 7 D 211/96 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/445 (2006.01)  
 C 0 7 D 409/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4535 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/20 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/56 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)  
 C 0 7 D 211/44 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/451 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/84 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/428 (2006.01)  
 C 0 7 D 239/70 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/517 (2006.01)  
 C 0 7 D 333/16 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/381 (2006.01)  
 C 0 7 D 277/24 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/425 (2006.01)  
 C 0 7 D 213/40 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4409 (2006.01)  
 C 0 7 D 307/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/341 (2006.01)  
 C 0 7 D 207/09 (2006.01)  
 C 0 7 D 213/75 (2006.01)  
 C 0 7 D 241/20 (2006.01)  
 C 0 7 D 285/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/433 (2006.01)  
 C 0 7 D 239/32 (2006.01)  
 C 0 7 D 239/26 (2006.01)  
 C 0 7 D 213/56 (2006.01)  
 C 0 7 D 309/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/351 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/22 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 35/42  
 C 0 7 C 255/53 C S P  
 A 6 1 K 31/122  
 A 6 1 K 31/06  
 A 6 1 K 31/11  
 C 0 7 D 295/08  
 A 6 1 K 31/5375  
 A 6 1 K 31/215  
 A 6 1 K 31/275

C 0 7 D 213/30  
A 6 1 K 31/4402  
A 6 1 K 31/19  
A 6 1 K 31/047  
A 6 1 K 31/255  
A 6 1 K 31/045  
A 6 1 K 31/137  
C 0 7 D 257/04 E  
A 6 1 K 31/41  
A 6 1 K 31/166  
A 6 1 K 31/27  
A 6 1 K 31/136  
C 0 7 D 317/38  
A 6 1 K 31/357  
C 0 7 D 295/08 Z  
A 6 1 K 31/4453  
A 6 1 K 31/15  
A 6 1 K 31/192  
A 6 1 K 31/40  
C 0 7 D 471/04 1 1 6  
A 6 1 K 31/4375  
C 0 7 D 249/08 5 1 4  
A 6 1 K 31/4196  
C 0 7 D 295/18 A  
A 6 1 K 31/495  
C 0 7 D 295/18 Z  
A 6 1 K 31/133  
C 0 7 D 413/04  
A 6 1 K 31/496  
C 0 7 D 271/06  
A 6 1 K 31/4245  
C 0 7 D 241/18  
A 6 1 K 31/4965  
C 0 7 D 239/47 Z  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/4406  
C 0 7 D 303/14  
A 6 1 K 31/336  
C 0 7 D 211/96  
A 6 1 K 31/445  
C 0 7 D 409/12  
A 6 1 K 31/4535  
C 0 7 D 277/56  
A 6 1 K 31/426  
C 0 7 D 295/08 A  
C 0 7 D 211/44  
A 6 1 K 31/451  
C 0 7 D 277/84  
A 6 1 K 31/428  
C 0 7 D 239/70

A 6 1 K 31/517  
 C 0 7 D 333/16  
 A 6 1 K 31/381  
 C 0 7 D 277/24  
 A 6 1 K 31/425  
 C 0 7 D 213/40  
 A 6 1 K 31/4409  
 C 0 7 D 307/14  
 A 6 1 K 31/341  
 C 0 7 D 207/09  
 C 0 7 D 213/75  
 C 0 7 D 241/20  
 C 0 7 D 285/12  
 A 6 1 K 31/433  
 C 0 7 D 257/04 C  
 C 0 7 D 239/32  
 C 0 7 D 239/26  
 C 0 7 D 213/56  
 C 0 7 D 309/14  
 A 6 1 K 31/351  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年3月19日(2007.3.19)

## 【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

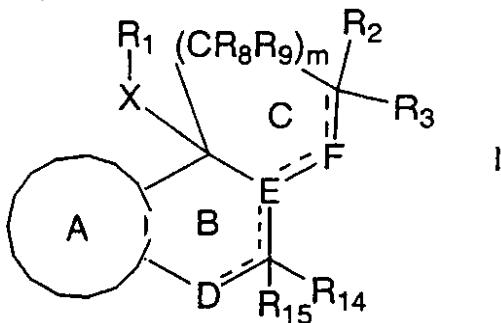
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

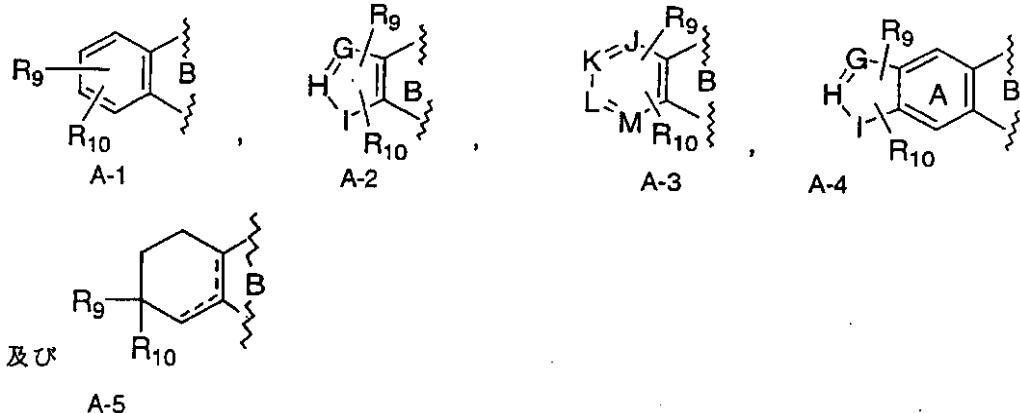
式 I :

## 【化1】



[式中、mは、1または2であり；  
 - - -は、所望による結合を表わし；  
 Aは、

## 【化2】



からなる群から選択され；

Dは、CR<sub>7</sub>、またはCR<sub>7</sub>R<sub>1~6</sub>であり；

Eは、C、またはCR<sub>6</sub>であり；

Fは、CR<sub>4</sub>、またはCR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>であり；

G、H及びIは、A環の2個の炭素原子またはB環の2個の炭素原子と一緒にになって、1個以上のN、OまたはS原子を含む5員複素環を形成し、但し、環当たりO及びSのうちのせいぜい1個が存在し；

J、K、L及びMは、B環の2個の炭素原子と一緒にになって、1個以上のN原子を含む6員複素環を形成し；

Xは、a) 存在しない、b) -CH<sub>2</sub>-、c) -CH(OH)-またはd) -C(O)-であり；

R<sub>1</sub>は、-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニル、または-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニルであり；

Zは、出現する毎に独立して、a) -(C<sub>0</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、b) -(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニルまたはc) -(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニルであり；

R<sub>2</sub>は、a) -H、b) -ハロ、c) -OH、d) Oまたは1個の-OHで置換された-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、e) -NR<sub>1~2</sub>R<sub>1~3</sub>、f) -Z-C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、g) -Z-C(O)NR<sub>1~2</sub>R<sub>1~3</sub>、h) -O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、i) -Z-O-C(O)-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、j) -Z-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-C(O)-NR<sub>1~2</sub>R<sub>1~3</sub>、k) -Z-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-C(O)-O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、l) -O-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニル、m) -O-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、n) -O-Z-het、o) -COOH、p) -C(OH)R<sub>1~2</sub>R<sub>1~3</sub>またはq) -Z-CNであり；

R<sub>3</sub>は、a) -H、b) -(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル、ここで、連結炭素原子以外の1または2個の炭素原子は、独立してS、O及びNから選択される1または2個のヘテロ原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は0、1または2個のR<sub>y</sub>で置換されている、c) O、1または2個のR<sub>y</sub>で置換された-(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)アルケニル、d) -(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)アルキニル、ここで、連結炭素原子以外の1個の炭素原子は、1個の酸素原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は0、1または2個のR<sub>y</sub>で置換されている、e) -CH=C=CH<sub>2</sub>、f) -CN、g) -(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル、h) -Z-アリール、i) -Z-het、j) -C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、k) -O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、l) -Z-S-R<sub>1~2</sub>、m) -Z-S(O)-R<sub>1~2</sub>、n) -Z-S(O)<sub>2</sub>-R<sub>1~2</sub>、o) -CF<sub>3</sub>、p) -NR<sub>1~2</sub>O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルまたはq) -CH<sub>2</sub>OR<sub>y</sub>、であり；

但し、C環のCR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>(7位)とF部分(8位)との間に二重結合が存在する場合は、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>のうちの1つは存在せず；

R<sub>y</sub>は、出現する毎に独立して、a) -OH、b) -ハロ、c) -Z-CF<sub>3</sub>、d) Z-CF(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、e) -CN、f) -NR<sub>1~2</sub>R<sub>1~3</sub>、g) -(C<sub>3</sub>~

$C_6$ ) シクロアルキル、 $h$ ) - ( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルケニル、 $i$ ) - ( $C_0 \sim C_3$ ) アルキル - アリール、 $j$ ) - het または  $k$ ) -  $N_3$  であり；

または  $R_2$  及び  $R_3$  は一緒になって、 $a$ ) = CHR<sub>1,1</sub>、 $b$ ) = NOR<sub>1,1</sub>、 $c$ ) = O、 $d$ ) = N - NR<sub>1,2</sub>、 $e$ ) = N - NR<sub>1,2</sub> - C(O) - R<sub>1,2</sub>、 $f$ ) オキシラニルまたは  $g$ ) 1,3-ジオキソラン-4-イルを形成し；

$R_4$  及び  $R_5$  は、出現する毎に独立して、 $a$ ) - H、 $b$ ) - CN、 $c$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $d$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルケニル、 $e$ ) 0~3個のハロで置換された - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $g$ ) 0~3個のハロで置換された - O - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルケニル、 $h$ ) 0~3個のハロで置換された - O - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルキニル、 $i$ ) ハロ、 $j$ ) - OH、 $k$ ) ( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルキルまたは  $l$ ) ( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルケニルであり；

または  $R_4$  及び  $R_5$  は一緒になって = O を形成し；

$R_6$  は、 $a$ ) - H、 $b$ ) - CN、 $c$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $d$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルケニル、 $e$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルキニルまたは  $f$ ) - OH であり；

$R_7$  及び  $R_{1,6}$  は、出現する毎に独立して、 $a$ ) - H、 $b$ ) - ハロ、 $c$ ) - CN、 $d$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $e$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルケニルまたは  $f$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルキニルであり；

または  $R_7$  及び  $R_{1,6}$  は一緒になって = O を形成し；

$R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{1,4}$  及び  $R_{1,5}$  は、出現する毎に独立して、 $a$ ) - H、 $b$ ) - ハロ、 $c$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $d$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルケニル、 $e$ ) 0~3個のハロで置換された - ( $C_2 \sim C_6$ ) アルキニル、 $f$ ) - CN、 $g$ ) - ( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルキル、 $h$ ) - ( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルケニル、 $i$ ) - OH、 $j$ ) - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $k$ ) - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルケニル、 $l$ ) - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキニル、 $m$ ) - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、 $n$ ) - C(O)OR<sub>1,2</sub> または  $o$ ) - C(O)NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub> であり；

または  $R_8$  及び  $R_9$  は一緒になって、C環上で = O を形成し；但し、 $m$  が 2 である場合は、 $R_8$  及び  $R_9$  の 1組のみが一緒になって = O を形成し；

または  $R_{1,4}$  及び  $R_{1,5}$  は一緒になって = O を形成し；但し、 $R_{1,4}$  及び  $R_{1,5}$  が一緒になって = O を形成する場合は、D は CR<sub>7</sub> 以外であり、また、E は C 以外であり；

$R_{1,0}$  は、 $a$ ) 独立して - ハロ、- OH 及び -  $N_3$  から選択される 0~3 個の置換基で置換された - ( $C_1 \sim C_{1,0}$ ) アルキル、 $b$ ) 独立して - ハロ、- OH 及び -  $N_3$  から選択される 0~3 個の置換基で置換された - ( $C_2 \sim C_{1,0}$ ) アルケニル、 $c$ ) 独立して - ハロ、- OH 及び -  $N_3$  から選択される 0~3 個の置換基で置換された - ( $C_2 \sim C_{1,0}$ ) アルキニル、 $d$ ) - ハロ、 $e$ ) - Z - CN、 $f$ ) - OH、 $g$ ) - Z - het、 $h$ ) - Z - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、 $i$ ) - Z - C(O) - het、 $j$ ) - Z - C(O) - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $k$ ) - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、 $l$ ) - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub> - Z - CN、 $m$ ) - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub> - Z - het、 $n$ ) - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub> - Z - アリール、 $o$ ) - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub> - Z - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、 $p$ ) - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub> - Z - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $q$ ) - ( $C_0 \sim C_6$ ) アルキル - C(O)OH、 $r$ ) - Z - C(O)O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $s$ ) - Z - O - ( $C_0 \sim C_6$ ) アルキル - het、 $t$ ) - Z - O - ( $C_0 \sim C_6$ ) アルキル - アリール、 $u$ ) 0~2 個の R<sub>x</sub> で置換された - Z - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $v$ ) - Z - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル - CH(O)、 $w$ ) - Z - O - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル - NR<sub>1,2</sub> - het、 $x$ ) - Z - O - Z - het - Z - het、 $y$ ) - Z - O - Z - het - Z - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、 $z$ ) - Z - O - Z - het - C(O) - het、 $a1$ ) - Z - O - Z - C(O) - het、 $b1$ ) - Z - O - Z - C(O) - het - het、 $c1$ ) - Z - O - Z - C(O) - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、 $d1$ ) - Z - O - Z - C(S) - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、 $e1$ ) - Z - O

- Z - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 f 1 ) - Z - O - Z - ( C<sub>1~C<sub>3</sub></sub> ) アルキル - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 g 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - O ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 h 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - OH 、 i 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> - O ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 j 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> - OH 、 k 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> - Z - het 、 m 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> - SO<sub>2</sub> - ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 n 1 ) - Z - O - Z - C ( = N R<sub>1~2</sub> ) ( N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> ) 、 o 1 ) - Z - O - Z - C ( = N O R<sub>1~2</sub> ) ( N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> ) 、 p 1 ) - Z - N R<sub>1~2</sub> - C ( O ) - O - Z - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 q 1 ) - Z - S - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 r 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 s 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - アリール、 t 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 u 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - CF<sub>3</sub> 、 v 1 ) - Z - N R<sub>1~2</sub> C ( O ) OR<sub>1~3</sub> または w 1 ) - Z - N R<sub>1~2</sub> C ( O ) R<sub>1~3</sub> であり；

または R<sub>9</sub> 及び R<sub>10</sub> は一緒になって、式 A - 5 の部分上で a ) = O または b ) = NO R<sub>1~2</sub> を形成し；

R<sub>1~1</sub> は、 a ) - H 、 b ) - ( C<sub>1~C<sub>5</sub></sub> ) アルキル、 c ) - ( C<sub>3~C<sub>6</sub></sub> ) シクロアルキルまたは d ) - ( C<sub>0~C<sub>3</sub></sub> ) アルキル - アリールであり；

R<sub>1~2</sub> 及び R<sub>1~3</sub> は、出現する毎に各々独立して、 a ) - H 、 b ) - ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、ここで、連結炭素原子以外の 1 または 2 個の炭素原子は、独立して S 、 O 及び N から選択される 1 または 2 個のヘテロ原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は 0 ~ 6 個のハロで置換されている、 c ) 0 ~ 6 個のハロで置換された - ( C<sub>2~C<sub>6</sub></sub> ) アルケニル、または d ) - ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキニル、ここで、連結炭素原子以外の 1 個の炭素原子は、 1 個の酸素原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は 0 ~ 6 個のハロで置換されている、であり；

または R<sub>1~2</sub> 及び R<sub>1~3</sub> は、 N と一緒にになって het を形成し；

または R<sub>6</sub> 及び R<sub>1~4</sub> または R<sub>1~5</sub> は一緒になって、 1 , 3 - ジオキソラニルを形成し；

アリールは、 a ) 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されたフェニル、 b ) 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されたナフチルまたは c ) 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されたビフェニルであり；

het は、独立して窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、 5 、 6 または 7 員の飽和、部分飽和または不飽和環であり；そして、上記の複素環の任意のものがベンゼン環かまたは別の複素環に縮合している任意の二環式基を含み；そして窒素は、 N - 酸化物形態を与えるような酸化された状態にあってよく；そして 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されており；

R<sub>x</sub> は、出現する毎に独立して、 a ) - ハロ、 b ) - OH 、 c ) - ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 d ) - ( C<sub>2~C<sub>6</sub></sub> ) アルケニル、 e ) - ( C<sub>2~C<sub>6</sub></sub> ) アルキニル、 f ) - O ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 g ) - O ( C<sub>2~C<sub>6</sub></sub> ) アルケニル、 h ) - O ( C<sub>2~C<sub>6</sub></sub> ) アルキニル、 i ) - ( C<sub>0~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 j ) - C ( O ) - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 k ) - Z - SO<sub>2</sub> R<sub>1~2</sub> 、 l ) - Z - SOR<sub>1~2</sub> 、 m ) - Z - SR<sub>1~2</sub> 、 n ) - N R<sub>1~2</sub> - SO<sub>2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 o ) - N R<sub>1~2</sub> - C ( O ) - R<sub>1~3</sub> 、 p ) - N R<sub>1~2</sub> - OR<sub>1~3</sub> 、 q ) - SO<sub>2</sub> - N R<sub>1~2</sub> R<sub>1~3</sub> 、 r ) - CN 、 s ) - CF<sub>3</sub> 、 t ) - C ( O ) ( C<sub>1~C<sub>6</sub></sub> ) アルキル、 u ) = O 、 v ) - Z - SO<sub>2</sub> - フェニルまたは w ) - Z - SO<sub>2</sub> - het ' であり；

アリール' は、フェニル、ナフチルまたはビフェニルであり；

het ' は、独立して窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、 5 、 6 または 7 員の飽和、部分飽和または不飽和環であり；そして、上記の複素環の任意のものがベンゼン環かまたは別の複素環に縮合している任意の二環式基を含む；

但し：

1 ) X - R<sub>1</sub> は、水素またはメチル以外であり；

2 ) R<sub>9</sub> 及び R<sub>10</sub> が A 環上の置換基である場合は、これらはモノまたはジメトキシ以

外であり；

3) R<sub>2</sub> 及び R<sub>3</sub> が一緒になって = C H R<sub>11</sub> または = O を形成し、ここで R<sub>11</sub> が - O (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルである場合は、- X - R<sub>1</sub> は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル以外であり；

4) R<sub>2</sub> 及び R<sub>3</sub> が一緒になって C = O を形成し、R<sub>9</sub> が A 環上の水素である場合か；または R<sub>2</sub> がヒドロキシであり、R<sub>3</sub> が水素であり、R<sub>9</sub> が A 環上の水素である場合は、A 環の 2 位において R<sub>10</sub> は、- O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルまたは - O - C H<sub>2</sub> - フェニル以外であり；

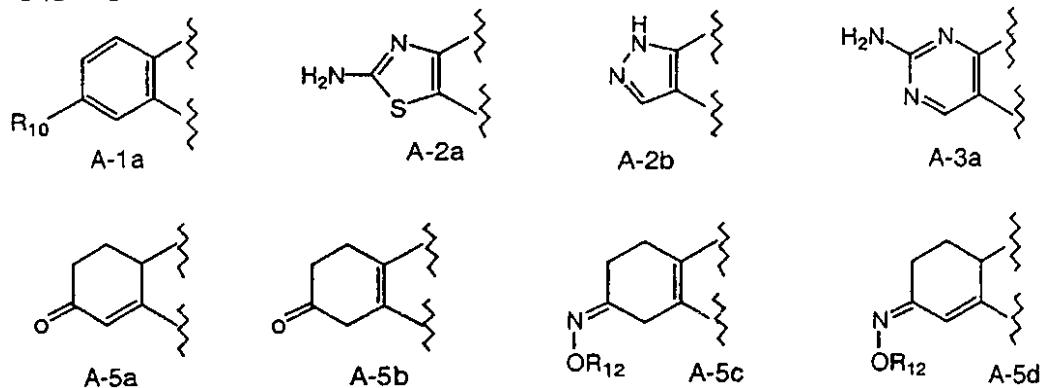
5) X - R<sub>1</sub> が (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルケニルまたは (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキニルである場合は、R<sub>9</sub> 及び R<sub>10</sub> は、モノヒドロキシまたは = O 以外であり、一緒になった場合にそのジオール形態を含む。】

の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 2】

A 環は：

#### 【化 3】



からなる群から選択され；

D は、C R<sub>7</sub>、または C R<sub>1~6</sub> R<sub>7</sub> であり；

E は、C、または C R<sub>6</sub> であり；

F は、C R<sub>4</sub>、または C R<sub>4</sub> R<sub>5</sub> であり；

X は、- C H<sub>2</sub> - である、

請求項 1 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

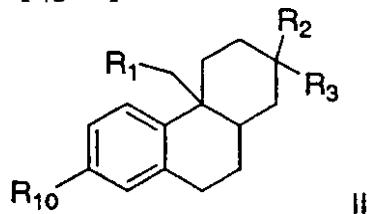
#### 【請求項 3】

D は C H<sub>2</sub> であり；E は C H であり；F は C H<sub>2</sub> であり；R<sub>8</sub> は - H であり；R<sub>9</sub> は - H であり；m は 2 であり；R<sub>1~4</sub> は - H であり；R<sub>1~5</sub> は - H であり；A 環は式 A - 1 a の部分である、請求項 2 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 4】

式 I I :

#### 【化 4】



[式中、R<sub>2</sub> は、a) - OH または b) - O - C H<sub>2</sub> - het であり；

R<sub>3</sub> は、a) - C F<sub>3</sub>、- C N、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、- フェニルまたは - N<sub>3</sub> のうちの 0 または 1 個で置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、b) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub>) アルキル、- C l、- C F<sub>3</sub>、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、- フェニルまたは

- ベンジルのうちの 1 個で置換された - C - C - ; c ) - CH<sub>2</sub>OH、d ) - CH<sub>2</sub>O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ) アルキル、ここで、1 個の炭素原子は、1 個の酸素原子で所望により置換されていてよい、e ) - CH<sub>2</sub>O ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> ) アルケニル、f ) - CH<sub>2</sub>O ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> ) アルキニル、ここで、1 個の炭素原子は、1 個の酸素原子で所望により置換されていてよい、g ) - CH<sub>2</sub>OR<sub>y</sub>、h ) - CN または i ) - CF<sub>3</sub>、であり；

R<sub>y</sub> は、a ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル - CF<sub>3</sub>、b ) - ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、c ) - フェニルまたは d ) - ベンジルであり；

または R<sub>2</sub> 及び R<sub>3</sub> は一緒になって、a ) - 1,3-ジオキソラン - 4-イルまたは b ) = NOR<sub>1,1</sub> を形成し；

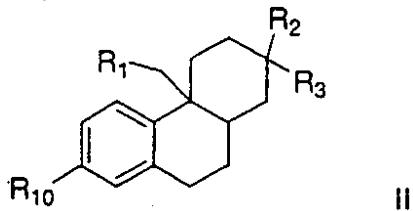
R<sub>1,1</sub> は、a ) - H、b ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ) アルキル、c ) - ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、d ) - フェニルまたは e ) - ベンジルである。】

の請求項 3 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 5】

式 I I :

#### 【化 5】



[ 式中、R<sub>1</sub> は、a ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル、または b ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルケニルであり；

Z は、出現する毎に独立して、- ( C<sub>0</sub> ~ C<sub>2</sub> ) アルキルであり；

R<sub>1,0</sub> は、a ) - CH(OH) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ) アルキル、b ) - CN、c ) - OH、d ) - het、e ) - C(O) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル、f ) - C(O) - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、g ) - C(O) - NH - Z - het、h ) - O - ( C<sub>0</sub> ~ C<sub>2</sub> ) アルキル - het、i ) - O - Z - C(O) - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、j ) - O - Z - C(O) - NH - ( C<sub>0</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル - het または k ) - O - Z - C(O) - NH - ( C<sub>0</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル - NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub> であり；

R<sub>1,2</sub> 及び R<sub>1,3</sub> は、独立して、a ) - H または b ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキルであり；

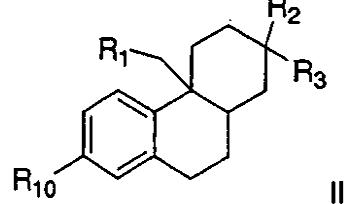
または R<sub>1,2</sub> 及び R<sub>1,3</sub> は、N と一緒にって het を形成する。】

の請求項 4 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 6】

式 I I :

#### 【化 6】



[ 式中、R<sub>1</sub> は、a ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル、または b ) - CH<sub>2</sub> - CH = CH<sub>2</sub> であり；

R<sub>2</sub> は、- OH であり；

R<sub>3</sub> は、a ) O または 1 個の CF<sub>3</sub> で置換された - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、b ) - C - CH<sub>3</sub>、c ) - C - C<sub>1</sub>、d ) - C - C - CF<sub>3</sub>、e ) O または 1 個の CF<sub>3</sub>

で置換された - C H<sub>2</sub> O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル、または f ) - C F<sub>3</sub> であり；

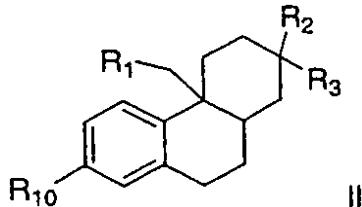
R<sub>10</sub> は - O H または - C N である。]

の請求項 5 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 7】

式 I I :

#### 【化 8】



[式中、R<sub>1</sub> は、a) - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、または b) - C H<sub>2</sub> - C H = C H<sub>2</sub> であり；

R<sub>2</sub> は - O H であり；

R<sub>3</sub> は、a) 0 または 1 個の C F<sub>3</sub> で置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、b) - C C - C H<sub>3</sub>、c) - C C - C 1、d) - C C - C F<sub>3</sub>、e) 0 または 1 個の C F<sub>3</sub> で置換された - C H<sub>2</sub> O (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、または f) - C F<sub>3</sub> であり；

R<sub>10</sub> は、- C (O) - NH - Z - h e t であり、ここで、h e t は、a) 0 または 1 個のメチルで置換されたピリジニル、b) ピリミジニル、c) ピラジニル、d) モルホリニル及び e) オキサジアゾリルからなる群から選択され；

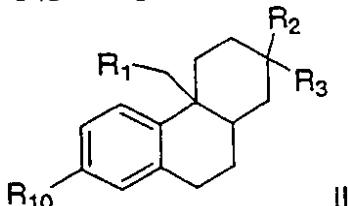
Z は、- (C<sub>0</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキルである。]

の請求項 5 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 8】

式 I I :

#### 【化 10】



[式中、R<sub>1</sub> は、a) - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、または b) - C H<sub>2</sub> - C H = C H<sub>2</sub> であり；

R<sub>2</sub> は - O H であり；

R<sub>3</sub> は、a) 0 または 1 個の C F<sub>3</sub> で置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、b) - C C - C H<sub>3</sub>、c) - C C - C 1、d) - C C - C F<sub>3</sub>、e) 0 または 1 個の C F<sub>3</sub> で置換された - C H<sub>2</sub> O (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル、または f) - C F<sub>3</sub> であり；

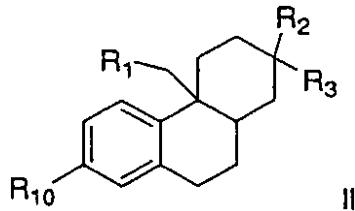
R<sub>10</sub> は、- O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル - h e t であり、ここで、h e t は、a) 0 または 1 個のメチルで置換されたピリジニル、b) ピリミジニル、c) ピラジニル、d) モルホリニル及び e) オキサジアゾリルからなる群から選択される。]

の請求項 5 に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

#### 【請求項 9】

式 I I :

## 【化12】



[式中、R<sub>1</sub>は、a) - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、またはb) - CH<sub>2</sub> - CH = CH<sub>2</sub>であり；

R<sub>2</sub>は-OHであり；

R<sub>3</sub>は、a)Oまたは1個のCF<sub>3</sub>で置換された-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、b) - C-C-CH<sub>3</sub>、c) - C-C-C1、d) - C-C-CF<sub>3</sub>、e)Oまたは1個のCF<sub>3</sub>で置換された-CH<sub>2</sub>O(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>)アルキル、またはf) - CF<sub>3</sub>であり；

R<sub>10</sub>は、a) - O - Z - C(O) - NH - (C<sub>0</sub> ~ C<sub>3</sub>)アルキル - N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、b) - O - Z - C(O) - NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、またはc) - O - Z - C(O) - NH - (C<sub>0</sub> ~ C<sub>3</sub>)アルキル - hetであり、ここで、hetは、1)Oまたは1個のメチルで置換されたピリジニル、2)ピリミジニル、3)ピラジニル、4)モルホリニル、5)ピロリジニル、6)イミダゾリル及び7)オキサジアゾリルからなる群から選択され；

R<sub>12</sub>及びR<sub>13</sub>は、独立して、a) - Hまたはb) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキルであり；またはR<sub>12</sub>及びR<sub>13</sub>は、Nと一緒にになってピロリジニルを形成し；

Zは-(C<sub>0</sub> ~ C<sub>1</sub>)アルキルである。]

の請求項5に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項10】

哺乳類における肥満、糖尿病、不安、うつ病、神経変性または炎症性疾患からなる群から選択される状態の治療のための薬剤の製造のための、請求項1に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩の使用。

## 【請求項11】

前記状態は肥満である、請求項10の使用。

## 【請求項12】

<sup>3</sup>アゴニスト、甲状腺模倣剤、摂食行動修正剤またはNPYアンタゴニストを投与することをさらに含む、請求項11の使用。

## 【請求項13】

第2の化合物はオルリストットまたはシプロトラミンである、請求項12の使用。

## 【請求項14】

前記状態は糖尿病である、請求項10の使用。

## 【請求項15】

アルドースレダクター阻害剤、グリコーゲンホスホリラーゼ阻害剤、ソルビトールデヒドロゲナーゼ阻害剤、インスリン、トログリタゾン、スルホニル尿素系薬、グリピジド、グリブリド、またはクロルプロパミドを投与することをさらに含む、請求項14の使用。

## 【請求項16】

治療上有効な量の請求項1に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩；及び薬学的に許容可能なキャリア、ビヒクリまたは希釈剤を含む医薬組成物。

## 【請求項17】

請求項1に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩である第1の化合物と；

<sup>3</sup>アゴニスト、甲状腺模倣剤、摂食行動修正剤またはNPYアンタゴニストである第

2 の化合物と；

薬剤用キャリア、ビヒクルまたは希釈剤と；  
を含む治療上有効な量の組成物を含む、医薬組合せ組成物。

【請求項 18】

a ) 第1の単位剤形の、請求項1に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩である第1の化合物、及び薬学的に許容可能なキャリア、ビヒクルまたは希釈剤と；

b ) 第2の単位剤形の、<sub>3</sub>アゴニスト、甲状腺模倣剤、摂食行動修正剤またはN P Yアンタゴニストである第2の化合物、及び薬学的に許容可能なキャリア、ビヒクルまたは希釈剤と；

c ) 前記第1の剤形と前記第2の剤形とを収容する容器と；  
を含むキットであって、前記第1の化合物及び前記第2の化合物の量は治療効果を生じる量である、前記キット。

【請求項 19】

哺乳類において体重減少を引き起こすための薬剤の製造のための、請求項1に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 20】

請求項1に記載の化合物、その異性体、または、前記化合物若しくは異性体の薬学的に許容可能な塩である第1の化合物と；

アルドースレダクターゼ阻害剤、グリコーゲンホスホリラーゼ阻害剤、ソルビトールデヒドロゲナーゼ阻害剤、インスリン、トログリタゾン、スルホニル尿素系薬、グリピジド、グリブリド、またはクロルプロパミドである第2の化合物と；

薬剤用キャリア、ビヒクルまたは希釈剤と；

を含む治療上有効な量の組成物を含む、医薬組合せ組成物。

【請求項 21】

哺乳類における炎症性疾患を治療するための、及び、該治療の望ましくない副作用を低減させるための薬剤の製造のための、請求項1に記載のグルココルチコイド受容体モジュレーター、及びグルココルチコイド受容体アゴニストの使用。

【請求項 22】

前記炎症性疾患は、関節炎、喘息、鼻炎及び免疫調節からなる群から選択される、請求項21の使用。

【請求項 23】

前記グルココルチコイド受容体アゴニストは、プレドニゾン、プレドニリデン、プレドニゾロン、コルチゾン、デキサメタゾン及びヒドロコルチゾンである、請求項21の使用。

【手続補正2】

【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】

からなる群から選択され；

Dは、C R<sub>7</sub>、C R<sub>7</sub> R<sub>1~6</sub>、N、N R<sub>7</sub> またはOであり；

Eは、C、C R<sub>6</sub> またはNであり；

Fは、C R<sub>4</sub>、C R<sub>4</sub> R<sub>5</sub> またはOであり；

G、H及びIは、A環の2個の炭素原子またはB環の2個の炭素原子と一緒にになって、1個以上のN、OまたはS原子を含む5員複素環を形成し、但し、環当りO及びSのうちのせいぜい1個が存在し；

J、K、L及びMは、B環の2個の炭素原子と一緒にになって、1個以上のN原子を含む6員複素環を形成し；

Xは、a) 存在しない、b) -CH<sub>2</sub>-、c) -CH(OH)-またはd) -C(O)-であり；

R<sub>1</sub>は、a) -H、b) -Z-CF<sub>3</sub>、c) -(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、d) -(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニル、e) -(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、f) -CHO、g) -CH=N-OR<sub>1,2</sub>、h) -Z-C(O)OR<sub>1,2</sub>、i) -Z-C(O)-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、j) -Z-C(O)-NR<sub>1,2</sub>-Z-het、k) -Z-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、l) -Z-NR<sub>1,2</sub>het、m) -Z-het、n) -Z-O-het、o) -Z-アリール'、p) -Z-O-アリール'、q) -CHOH-アリール'またはr) -C(O)-アリール'であり(ここで、置換基o)~r)中のアリール'は独立して、以下のもののうちの0、1または2個で置換されており：-Z-OH、-Z-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、-Z-NR<sub>1,2</sub>-het、-C(O)NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、-C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)OH、-C(O)-het、-NR<sub>1,2</sub>-C(O)-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-NR<sub>1,2</sub>-C(O)-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニル、-NR<sub>1,2</sub>-C(O)-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、-NR<sub>1,2</sub>-C(O)-Z-het、-CN、-Z-het、-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-C(O)-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-NR<sub>1,2</sub>-Z-C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-N(Z-C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル)、-NR<sub>1,2</sub>-Z-C(O)-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、-Z-NR<sub>1,2</sub>-SO<sub>2</sub>-R<sub>1,3</sub>、-NR<sub>1,2</sub>-SO<sub>2</sub>-het、-C(O)H、-Z-NR<sub>1,2</sub>-Z-O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-Z-NR<sub>1,2</sub>-Z-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、-Z-NR<sub>1,2</sub>-(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル、-Z-N(Z-O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル)、-SO<sub>2</sub>R<sub>1,2</sub>、-SOR<sub>1,2</sub>、-SR<sub>1,2</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、-O-C(O)-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-O-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-ハロまたは-CF<sub>3</sub>)；

Zは、出現する毎に独立して、a) -(C<sub>0</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、b) -(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニルまたはc) -(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニルであり；

R<sub>2</sub>は、a) -H、b) -ハロ、c) -OH、d) Oまたは1個の-OHで置換された-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、e) -NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、f) -Z-C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、g) -Z-C(O)NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、h) -O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、i) -Z-O-C(O)-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、j) -Z-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-C(O)-NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、k) -Z-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-C(O)-O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、l) -O-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルケニル、m) -O-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、n) -O-Z-het、o) -COOH、p) -C(OH)R<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>またはq) -Z-CNであり；

R<sub>3</sub>は、a) -H、b) -(C<sub>1</sub>~C<sub>1,0</sub>)アルキル、ここで、連結炭素原子以外の1または2個の炭素原子は、独立してS、O及びNから選択される1または2個のヘテロ原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は0、1または2個のR<sub>y</sub>で置換されており、c) O、1または2個のR<sub>y</sub>で置換された-(C<sub>2</sub>~C<sub>1,0</sub>)アルケニル、d) -(C<sub>2</sub>~C<sub>1,0</sub>)アルキニル、ここで、連結炭素原子以外の1個の炭素原子は、1個の酸素原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は0、1または2個のR<sub>y</sub>で置換されており、e) -CH=C=CH<sub>2</sub>、f) -CN、g) -(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル、h) -Z-アリール、i) -Z-het、j) -C(O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、k) -O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、l) -Z-S-R<sub>1,2</sub>、m) -Z-S(O)-R<sub>1,2</sub>、n) -Z-S(O)<sub>2</sub>-R<sub>1,2</sub>、o) -CF<sub>3</sub>、p) -NR<sub>1,2</sub>O-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルまたはq) -CH<sub>2</sub>OR<sub>y</sub>であり；

但し、C環のCR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>(7位)とF部分(8位)との間に二重結合が存在する場合は、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>のうちの1つは存在せず；

R<sub>y</sub>は、出現する毎に独立して、a) -OH、b) -ハロ、c) -Z-CF<sub>3</sub>、d) Z-CF(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル)、e) -CN、f) -NR<sub>1,2</sub>R<sub>1,3</sub>、g) -(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル、h) -(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルケニル、i) -(C<sub>0</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル-アリール、j) -hetまたはk) -N<sub>3</sub>であり；

またはR<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>は一緒になって、a) = C H R<sub>1-1</sub>、b) = N O R<sub>1-1</sub>、c) = O、d) = N - N R<sub>1-2</sub>、e) = N - N R<sub>1-2</sub> - C(O) - R<sub>1-2</sub>、f) オキシラニルまたはg) 1,3-ジオキソラン-4-イルを形成し；

R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、出現する毎に独立して、a) - H、b) - CN、c) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、d) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルケニル、e) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキニル、f) 0~3個のハロで置換された - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、g) 0~3個のハロで置換された - O - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルケニル、h) 0~3個のハロで置換された - O - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキニル、i) ハロ、j) - OH、k) (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキルまたはl) (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルケニルであり；

またはR<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は一緒になって=Oを形成し；

R<sub>6</sub>は、a) - H、b) - CN、c) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、d) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルケニル、e) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキニルまたはf) - OHであり；

R<sub>7</sub>及びR<sub>1-6</sub>は、出現する毎に独立して、a) - H、b) - ハロ、c) - CN、d) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、e) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルケニルまたはf) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキニルであり；但し、DがNR<sub>7</sub>である場合は、R<sub>7</sub>は-CNまたは-ハロ以外であり；

またはR<sub>7</sub>及びR<sub>1-6</sub>は一緒になって=Oを形成し；

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>1-4</sub>及びR<sub>1-5</sub>は、出現する毎に独立して、a) - H、b) - ハロ、c) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、d) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルケニル、e) 0~3個のハロで置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキニル、f) - CN、g) - (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、h) - (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルケニル、i) - OH、j) - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、k) - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルケニル、l) - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキニル、m) - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、n) - C(O)OR<sub>1-2</sub>またはo) - C(O)NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>であり；

またはR<sub>8</sub>及びR<sub>9</sub>は一緒になって、C環上で=Oを形成し；但し、mが2である場合は、R<sub>8</sub>及びR<sub>9</sub>の1組のみが一緒になって=Oを形成し；

またはR<sub>1-4</sub>及びR<sub>1-5</sub>は一緒になって=Oを形成し；但し、R<sub>1-4</sub>及びR<sub>1-5</sub>が一緒になって=Oを形成する場合は、DはCR<sub>7</sub>以外であり、また、EはC以外であり；

R<sub>1-0</sub>は、a) 独立して - ハロ、- OH及び-N<sub>3</sub>から選択される0~3個の置換基で置換された - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>1-0</sub>) アルキル、b) 独立して - ハロ、- OH及び-N<sub>3</sub>から選択される0~3個の置換基で置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1-0</sub>) アルケニル、c) 独立して - ハロ、- OH及び-N<sub>3</sub>から選択される0~3個の置換基で置換された - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>1-0</sub>) アルキニル、d) - ハロ、e) - Z - CN、f) - OH、g) - Z - het、h) - Z - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、i) - Z - C(O) - het、j) - Z - C(O) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、k) - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、l) - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub> - Z - CN、m) - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub> - Z - het、n) - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub> - Z - アリール、o) - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub> - Z - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、p) - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub> - Z - O(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、q) - (C<sub>0</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル - C(O)OH、r) - Z - C(O)O(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、s) - Z - O - (C<sub>0</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル - het、t) - Z - O - (C<sub>0</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル - アリール、u) 0~2個のR<sub>x</sub>で置換された - Z - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、v) - Z - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル - CH(O)、w) - Z - O - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル - NR<sub>1-2</sub> - het、x) - Z - O - Z - het - Z - het、y) - Z - O - Z - het - Z - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、z) - Z - O - Z - het - C(O) - het、a1) - Z - O - Z - C(O) - het、b1) - Z - O - Z - C(O) - het - het、c1) - Z - O - Z - C(O) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、d1) - Z - O - Z - C(S) - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、e1) - Z - O - Z - C(O) - NR<sub>1-2</sub>R<sub>1-3</sub>、f1) - Z - O - Z - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキル - C(

O ) - N R<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 g 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 h 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - OH、 i 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 j 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - OH、 k 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - Z - het、 m 1 ) - Z - O - Z - C ( O ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - SO<sub>2</sub> - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 n 1 ) - Z - O - Z - C ( = NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> ) ( NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> ) 、 o 1 ) - Z - O - Z - C ( = NOR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> ) ( NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> ) 、 p 1 ) - Z - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - C ( O ) - O - Z - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 q 1 ) - Z - S - C ( O ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 r 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 s 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - アリール、 t 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 u 1 ) - Z - O - SO<sub>2</sub> - CF<sub>3</sub> 、 v 1 ) - Z - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> C ( O ) OR<sub>1</sub> R<sub>3</sub> または w 1 ) - Z - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> C ( O ) R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> であり；

または R<sub>9</sub> 及び R<sub>10</sub> は一緒になって、式 A - 5 の部分上で a ) = O または b ) = NO R<sub>1</sub> R<sub>2</sub> を形成し；

R<sub>1</sub> は、 a ) - H、 b ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ) アルキル、 c ) - ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキルまたは d ) - ( C<sub>0</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル - アリールであり；

R<sub>1</sub> 2 及び R<sub>1</sub> 3 は、出現する毎に各々独立して、 a ) - H、 b ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、ここで、連結炭素原子以外の 1 または 2 個の炭素原子は、独立して S、O 及び N から選択される 1 または 2 個のヘテロ原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は 0 ~ 6 個のハロで置換されており、 c ) 0 ~ 6 個のハロで置換された - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルケニル、または d ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキニル、ここで、連結炭素原子以外の 1 個の炭素原子は、1 個の酸素原子で所望により置換されてよく、また、ここで、各炭素原子は 0 ~ 6 個のハロで置換されており；

または R<sub>1</sub> 2 及び R<sub>1</sub> 3 は、N と一緒にになって het を形成し；

または R<sub>6</sub> 及び R<sub>1</sub> 4 または R<sub>1</sub> 5 は一緒になって、 1 , 3 - ジオキソラニルを形成し；

アリールは、 a ) 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されたフェニル、 b ) 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されたナフチルまたは c ) 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されたビフェニルであり；

het は、独立して窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、5、6 または 7 員の飽和、部分飽和または不飽和環であり；そして、上記の複素環の任意のものがベンゼン環かまたは別の複素環に縮合している任意の二環式基を含み；そして窒素は、N - 酸化物形態を与えるような酸化された状態にあってよく；そして 0 ~ 3 個の R<sub>x</sub> で置換されており；

R<sub>x</sub> は、出現する毎に独立して、 a ) - ハロ、 b ) - OH、 c ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 d ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルケニル、 e ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキニル、 f ) - O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 g ) - O ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルケニル、 h ) - O ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキニル、 i ) - ( C<sub>0</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 j ) - C ( O ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 k ) - Z - SO<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>2</sub> 、 l ) - Z - SOR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> 、 m ) - Z - SR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> 、 n ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - SO<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 o ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - C ( O ) - R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 p ) - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> - OR<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 q ) - SO<sub>2</sub> - NR<sub>1</sub> R<sub>2</sub> R<sub>1</sub> R<sub>3</sub> 、 r ) - CN、 s ) - CF<sub>3</sub> 、 t ) - C ( O ) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル、 u ) = O、 v ) - Z - SO<sub>2</sub> - フェニルまたは w ) - Z - SO<sub>2</sub> - het' であり；

アリール' は、フェニル、ナフチルまたはビフェニルであり；

het' は、独立して窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、5、6 または 7 員の飽和、部分飽和または不飽和環であり；そして、上記の複素環の任意のものがベンゼン環かまたは別の複素環に縮合している任意の二環式基を含み；

但し：

1 ) X - R<sub>1</sub> は、水素またはメチル以外であり；

2 ) R<sub>9</sub> 及び R<sub>10</sub> が A 環上の置換基である場合は、これらはモノまたはジメトキシ以外であり；

3)  $R_2$  及び  $R_3$  が一緒になって  $=CHR_{11}$  または  $=O$  を形成し、ここで  $R_{11}$  が  $-O(C_1 \sim C_6)$  アルキルである場合は、 $-X-R_1$  は  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル以外であり；

4)  $R_2$  及び  $R_3$  が一緒になって  $=O$  を形成し、 $R_9$  が A 環上の水素である場合か；または  $R_2$  がヒドロキシであり、 $R_3$  が水素であり、 $R_9$  が A 環上の水素である場合は、A 環の 2 位において  $R_{10}$  は、 $-O-(C_1 \sim C_6)$  アルキルまたは  $-O-CH_2-$  フェニル以外であり；

5)  $X-R_1$  が  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$  アルケニルまたは  $(C_2 \sim C_4)$  アルキニルである場合は、 $R_9$  及び  $R_{10}$  は、モノヒドロキシまたは  $=O$  以外であり、一緒になった場合にそのジオール形態を含み；

6)  $X$  が存在しない場合は、 $R_1$  は、B 環及び C 環の連結箇所に直接に連結する N、O または S から選択されるヘテロ原子を含む部分以外である。】

の化合物、その異性体、前記化合物及び異性体のプロドラッグ、並びに、前記化合物、異性体及びプロドラッグの薬学的に許容可能な塩を提供する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0160

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0160】

het という用語は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する、所望により置換された 5、6 または 7 員の飽和、部分飽和または不飽和複素環を指し；そして、上記の複素環の任意のものがベンゼン環かまたは別の複素環に縮合している任意の二環式基を含み；そして窒素原子は、N - 酸化物形態を与えるような酸化された状態にあってよく；そして、0 ~ 3 個の独立した置換基によって置換されている。