

【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26年10月30日(2014.10.30)

【公表番号】特表2013-538786(P2013-538786A)

【公表日】平成25年10月17日(2013.10.17)

【年通号数】公開・登録公報2013-057

【出願番号】特願2013-515601(P2013-515601)

【国際特許分類】

C 0 7 D 267/10 (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)

A 6 1 P 15/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 267/10 C S P

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 13/00

A 6 1 K 31/553

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 417/06

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 413/04

C 0 7 D 498/08

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

C 0 7 D 487/04 1 4 7

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成26年9月5日(2014.9.5)

【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】請求項2

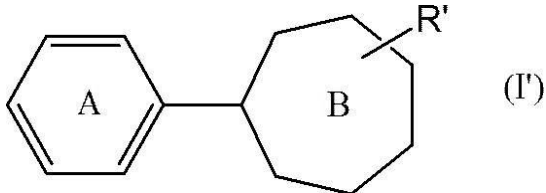
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項2】

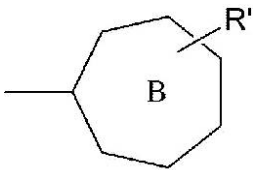
式(I')

【化6】



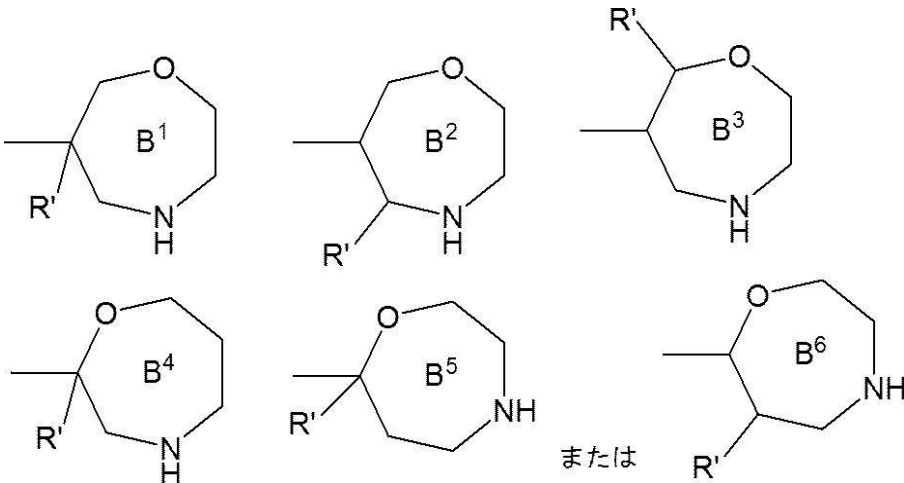
〔式中、  
環Aは、置換されていてもよい6員芳香環を表し、

【化7】



で表される基は、

【化8】



(式中、環B<sup>1</sup>～B<sup>6</sup>はさらに置換されていてもよい。ただし、環B<sup>1</sup>～B<sup>6</sup>を構成する窒素原子に結合した水素原子は置換されない。R'は、ヒドロキシ基、シアノ基、置換されていてもよいカルボキシ基、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、または置換されていてもよいカルバモイル基を表す。)を表す。

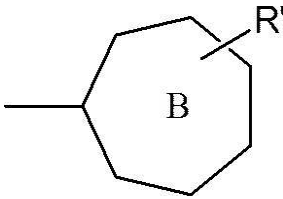
この場合において、環A上の置換基同士が結合して、環Aと共に、置換されていてもよい9または10員芳香族縮合環を形成してもよい。]

で表される化合物

(但し、

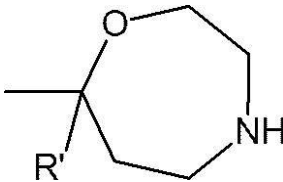
(1)式(I')の部分構造:

## 【化 9】



は、

## 【化 10】



を表し、

環 A は、ベンゼン環を表し、

R' は、 $R^x - CH_2 -$  ( $R^x$  は、ハロゲン原子およびメトキシ基から選択される置換基で置換されていてもよいフェノキシ基) を表す化合物、

(2) 2-メチル-2-フェニル-1,4-オキサゼパン、

(3) 6-メチル-6-フェニル-1,4-オキサゼパン、

(4) (2R)-2-フェニル-2-(トリフルオロメチル)-1,4-オキサゼパン、

(5) 7-メチル-7-フェニル-1,4-オキサゼパン、

(6) (6R,7R)-6-ヒドロキシ-7-フェニル-1,4-オキサゼパン-5-オン、および

(7) 7-ヒドロキシ-7-(4-メトキシフェニル)-1,4-オキサゼパン-2-オンを除く。) またはその塩。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0137

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0137】

R は、好ましくは、

(1) ヒドロキシ基、

(2) シアノ基、

(3) カルボキシ基、

(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ-カルボニル基 (好ましくは、エトキシカルボニル)、

(5) アミノ基、

(6) モノ-またはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (好ましくは、ジメチルアミノ)、

(7) モノ-またはジ- $C_{7-12}$  アラルキルアミノ基 (好ましくは、ベンジルアミノ)

、

(8) モノ-またはジ- ( $C_{1-6}$  アルキルスルホニル) アミノ基 (好ましくは、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ)、

(9) モノ-またはジ- ( $C_{3-6}$  シクロアルキルスルホニル) アミノ基 (好ましくは、シクロプロピルスルホニルアミノ)、

(10) モノ-またはジ- ( $C_{6-12}$  アリールスルホニル) アミノ基 (好ましくは、フェニルスルホニルアミノ)、

(11) モノ-またはジ- (芳香族複素環スルホニル) アミノ基 (好ましくは、ピリジルスルホニルアミノ (好ましくは、ピリジン-3-イルスルホニルアミノ))、

(12)  $-NR^A - CO - R^B$

[ 式中、

$R^A$  は、

( a ) 水素原子、または

( b )  $C_{1-6}$  アルキル基 ( 好ましくは、メチル ) を表し、

$R^B$  は、

( a ) ( i ) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子 )、

( ii ) ヒドロキシ基、

( iii )  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ )、

( iv ) 芳香族複素環基 ( 好ましくは、トリアゾリル ( 好ましくは、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ) )、および

( v ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )

から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 または 2 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 ( 好ましくは、メチル、エチル )、

( b )  $C_{3-6}$  シクロアルキル基 ( 好ましくは、シクロプロピル )、

( c )  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル基 ( 好ましくは、アセチル )、

( d ) アミノ基、

( e ) モノ -、またはジ -  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 ( 好ましくは、メチルアミノ )、

( f ) 環状アミノ基 ( 好ましくは、モルホリノ )、

( g ) ( i ) シアノ基、

( ii ) カルボキシ基、

( iii )  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、エトキシカルボニル )、

( iv )  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ基 ( 好ましくは、メチルスルホニルアミノ )、および

( v ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )

から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリール基 ( 好ましくは、フェニル )、

( h ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) ) で置換されていてもよい  $C_{7-12}$  アラルキル基 ( 好ましくは、ベンジル )、または

( i ) 芳香族複素環基 ( 好ましくは、オキサゾリル ( 好ましくは、オキサゾール - 5 - イル ) ) を表す。 ]、

( 13 ) -  $NR^C - SO_2 - N(R^D)(R^E)$

[ 式中、

$R^C$  は、

( a ) 水素原子、または

( b )  $C_{1-6}$  アルキル基 ( 好ましくは、メチル ) を表し、

$R^D$  および  $R^E$  は、それぞれ独立して、

( a ) 水素原子、

( b )  $C_{1-6}$  アルキル基 ( 好ましくは、メチル、エチル )、または

( c )  $C_{3-6}$  シクロアルキル基 ( 好ましくは、シクロプロピル ) を表す。 ]、

または

( 14 ) 置換されていてもよい環状アミノ基 ( 好ましくは、1 または 2 個のオキソ基で置換されていてもよい環状アミノ基 ( 好ましくは、イミダゾリジニル ( 好ましくは、イミダ

ゾリジン - 1 - イル) )、

( 1 5 ) ( a ) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子 )、

( b ) シアノ基、

( c ) ヒドロキシ基、

( d ) カルボキシ基、

( e ) アミノ基、

( f ) カルバモイル基、

( g ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキル ) カルバモイル基 ( 好ましくは、イソプロピルカルバモイル ) ( 該  $C_{1-6}$  アルキルは、カルボキシ基で置換されていてもよい )、

( h ) モノ - またはジ - (  $C_{6-12}$  アリール ) カルバモイル基 ( 好ましくは、フェニルカルバモイル ) ( 該  $C_{6-12}$  アリールは、カルボキシ基で置換されていてもよい )、

( i ) ( i ) ヒドロキシ基、

( i i ) カルボキシ基、

( i i i ) カルバモイル基、

( i v ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル ) アミノ基 ( 好ましくは、アセチルアミノ )、

( v ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル ) アミノ基 ( 好ましくは、メチルスルホニルアミノ )、

( v i )  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、エトキシカルボニル )、および

( v i i ) ヒドロキシ基で置換されていてもよい環状アミノカルボニル基 ( 好ましくは、アゼチジン - 1 - イルカルボニル、1, 1 - ジオキシドチオモルホリノカルボニル )

から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 または 2 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ )、

( j )  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニルオキシ基 ( 好ましくは、アセチルオキシ )

、

( k )  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルオキシ基 ( 好ましくは、メチルスルホニルオキシ )、

( l ) ( i ) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子、塩素原子 )、

( i i ) シアノ基、

( i i i ) カルボキシ基、

( i v )  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ )、

( v )  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、メトキシカルボニル )、

( v i )  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基 ( 好ましくは、メチルスルホニル )、

( v i i ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル ) カルバモイル基 ( 好ましくは、メチルスルホニルカルバモイル )、

( v i i i ) オキソ基またはチオキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )、および

( i x ) ヒドロキシ基で置換されていてもよい環状アミノカルボニル基 ( 好ましくは、アゼチジン - 1 - イルカルボニル )

から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 または 2 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールオキシ基 ( 好ましくは、フェノキシ )、

( m ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール -

3 - イル) ) で置換されていてもよい  $C_{7-12}$  アラルキルオキシ基 (好ましくは、ベンジルオキシ)、

(n) (i) カルボキシ基、

(ii)  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 (好ましくは、メトキシカルボニル)、および

(iii) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル)) から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環オキシ基 (好ましくは、ピリジルオキシ (好ましくは、ピリジン - 2 - イルオキシ))、

(o)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基 (好ましくは、メチルチオ)、

(p) カルボキシ基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールチオ基 (好ましくは、フェニルチオ)、

(q)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基 (好ましくは、メチルスルフィニル)、

(r)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基 (好ましくは、メチルスルホニル)、

(s) (i) カルボキシ基、および

(ii) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールスルホニル基 (好ましくは、フェニルスルホニル)、

(t) モノ - またはジ -  $C_{1-6}$  アルキルスルファモイル基 (好ましくは、イソプロピルスルファモイル)、

(u) (i) カルボキシ基、および

(ii) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環アミノ基 (好ましくは、ピリジリアミノ (好ましくは、ピリジン - 2 - イルアミノ)、ピリミジニルアミノ (好ましくは、ピリミジン - 2 - イルアミノ)、ベンゾオキサゾリルアミノ (好ましくは、ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ))、

(v) - NR<sup>F</sup> - CO - R<sup>G</sup>

[ 式中、

R<sup>F</sup> は、

(i) 水素原子、または

(ii) ヒドロキシ基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル) を表し、

R<sup>G</sup> は、

(i) (1) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子)、

(2) シアノ基、

(3) ヒドロキシ基、

(4) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子) および  $C_{3-6}$  シクロアルキル基 (好ましくは、シクロプロピル) から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、イソブトキシ)、

(5)  $C_{3-6}$  シクロアルキルオキシ基 (好ましくは、シクロプロピルオキシ)、

(6) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子、塩素原子)、シアノ基およびカルボキシ基から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換さ

れていてもよい芳香族複素環オキシ基（好ましくは、ピリジルオキシ（好ましくは、ピリジン - 2 - イルオキシ）、ピリミジニルオキシ（好ましくは、ピリミジン - 2 - イルオキシ））、

(7) モノ - またはジ -  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（好ましくは、メチルアミノ、ジメチルアミノ）、

(8) N - ( $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル) - N - ( $C_{1-6}$  アルキル) アミノ基（好ましくは、N - アセチル - N - メチルアミノ）、

(9) モノ - またはジ - ( $C_{6-12}$  アリール - カルボニル) アミノ基（好ましくは、ベンゾイルアミノ）、

(10) モノ - またはジ - (芳香族複素環カルボニル) アミノ基（好ましくは、ピリジルカルボニルアミノ（好ましくは、ピリジン - 2 - イルカルボニルアミノ））、

(11) N - (芳香族複素環カルボニル) - N - ( $C_{1-6}$  アルキル) アミノ基（好ましくは、N - (ピリジルカルボニル) - N - メチルアミノ（好ましくは、N - (ピリジン - 2 - イルカルボニル) - N - メチルアミノ））、

(12) モノ - またはジ - ( $C_{6-12}$  アリールスルホニル) アミノ基（好ましくは、フェニルスルホニルアミノ）、

(13)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基（好ましくは、メチルチオ）、

(14)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基（好ましくは、メチルスルホニル）、

(15)  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニルオキシ基（好ましくは、アセチルオキシ）、

(16) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））、およびカルボキシ基から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 個）の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールオキシ基（好ましくは、フェノキシ）、

(17) カルボキシ基および  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル）から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 または 2 個）の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、ピリジル（好ましくは、ピリジン - 2 - イル）、ピラゾリル（好ましくは、ピラゾール - 1 - イル）、イソオキサゾリル（好ましくは、イソオキサゾール - 5 - イル）、トリアゾリル（好ましくは、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル）、テトラゾリル（好ましくは、テトラゾール - 1 - イル））、

(18) ハロゲン原子（好ましくは、フッ素原子、塩素原子）およびオキシ基から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 または 2 個）の置換基で置換されていてもよい環状アミノ基（好ましくは、1 - ピロリジニル、ペペリジノ、1 - イミダゾリジニル、モルホリノ、8 - オキサ - 3 - アザピシクロ [3.2.1] オクタン - 3 - イル）、および

(19) ハロゲン原子（好ましくは、塩素原子）およびオキシ基から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 または 2 個）の置換基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロピリジル（好ましくは、1 - ジヒドロピリジル（好ましくは、1, 2 - ジヒドロピリジン - 1 - イル））、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル）、

(ii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ、イソプロポキシ）

(iii)  $C_{3-6}$  シクロアルキル基（好ましくは、シクロプロピル）、

(iv) (1) ハロゲン原子（好ましくは、フッ素原子、塩素原子）、

(2) シアノ基、

- (3) ヒドロキシ基、  
 (4) カルボキシ基、  
 (5) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル、tert - ブチル）、  
 (6)  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ、エトキシ）、  
 (7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基（好ましくは、メチルスルホニル）、  
 (8) モノ - またはジ - ( $C_{1-6}$  アルキルスルホニル) アミノ基（好ましくは、メチルスルホニルアミノ）、  
 (9)  $C_{6-12}$  アリール基（好ましくは、フェニル）、および  
 (10)  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル）で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、オキサジアゾリル（好ましくは、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル）、テトラゾリル（好ましくは、テトラゾール - 5 - イル））、  
 (11) オキシ基で置換されていてもよい環状アミノ基（好ましくは、1 - ピロリジニル）、および  
 (12) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリール基（好ましくは、フェニル）、  
 (v) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））で置換されていてもよい  $C_{7-12}$  アラルキル基（好ましくは、ベンジル）、  
 (vi) (1)  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル）、  
 (2) モノ - またはジ - ( $C_{1-6}$  アルキルスルホニル) アミノ基（好ましくは、メチルスルホニルアミノ）、および  
 (3) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 個）の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、ピリジル（好ましくは、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル）、チアゾリル（好ましくは、チアゾール - 5 - イル））、  
 (vii) 1 または 2 個のオキシ基で置換されていてもよい環状アミノ基（好ましくは、1 - ピロリジニル、モルホリノ、1, 1 - ジオキシドチオモルホリノ）、  
 (viii) 1 または 2 個のオキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロピリジル（好ましくは、1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - イル）、テトラヒドロフリル（好ましくは、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル）、テトラヒドロピラニル（好ましくは、テトラヒドロピラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 4 - イル）、ジオキサニル（好ましくは、1, 4 - ジオキサニル - 2 - イル））、  
 (ix)  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル基（好ましくは、アセチル、エチルカルボニル）、または  
 (x) 環状アミノカルボニル基（好ましくは、ピロリジン - 1 - イルカルボニル）を表す。 ]、  
 (w) - NR<sup>H</sup> - SO<sub>2</sub> - R<sup>I</sup>

[ 式中、

$R^H$  は、

(i) 水素原子、

(ii)  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル)、または

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) で置換されていてもよい  $C_{7-12}$  アラルキル基 (好ましくは、ベンジル) を表し、

$R^I$  は、

(i) (1) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子)、

(2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ)、および

(3) 環状アミノ基 (好ましくは、モルホリノ)

から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル、イソプロピル)、

(ii) (1) カルボキシ基、および

(2) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリール基 (好ましくは、フェニル)、または

(iii) (1) カルボキシ基、および

(2) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、ピリジル (好ましくは、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル)、フリル (好ましくは、フラン - 2 - イル)) を表す。]、

(x) -  $NR^J - CO - NR^K R^L$

[ 式中、

$R^J$  は、

(i) 水素原子、または

(ii) ヒドロキシ基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル) を表し、

$R^K$  および  $R^L$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子、

(ii) ヒドロキシ基および  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル、tert - ブチル)、または

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ)

を表す。]、

(y) -  $NR^M - SO_2 - NR^N R^O$

[ 式中、

$R^M$  は、

(i) 水素原子、または

(ii)  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル) を表し、

$R^N$  および  $R^O$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子、

(ii)  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル)、または

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) を表す。]、

(z) (i) カルボキシ基、

(ii) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子)、ヒドロキシ基およびカルボキシ基から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル)、

( i i i ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) で置換されていてもよい C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 (好ましくは、エトキシ、tert - ブトキシ)、

( i v ) C<sub>3</sub> - 6 シクロアルキル基 (好ましくは、シクロプロピル)、および

( v ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) )

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、ピラゾリル (好ましくは、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル)、オキサジアゾリル (好ましくは、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)、チアゾリル (好ましくは、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル)、トリアゾリル (好ましくは、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル)、インダゾリル (好ましくは、1H - インダゾール - 1 - イル)、ベンゾイミダゾリル (好ましくは、1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) )、

( a a ) ( i ) シアノ基、

( i i ) カルボキシ基、

( i i i ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 (好ましくは、メチル)、

( i v ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ - カルボニル基 (好ましくは、エトキシカルボニル)、

( v ) モノ - またはジ - ( C<sub>1</sub> - 6 アルキル - カルボニル ) アミノ基 (好ましくは、アセチルアミノ)、

( v i ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) )、および

( v i i ) オキソ基

から選択される 1 ないし 4 個の置換基で置換されていてもよい環状アミノ基 (好ましくは、1 - アゼチジニル、1 - ピロリジニル、ピペリジノ、1 - イミダゾリジニル、1 - ジヒドロピリダジニル (好ましくは、2, 3 - ジヒドロピリダジン - 2 - イル)、1 - ヘキサヒドロピリミジニル、2 - ジヒドロイソインドリル (好ましくは、1, 3 - ジヒドロ - 2H - イソインドール - 2 - イル)、3 - ジヒドロキナゾリニル (好ましくは、3, 4 - ジヒドロキナゾリン - 3 - イル)、3 - テトラヒドロキナゾリニル (好ましくは、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキナゾリン - 3 - イル)、3 - テトラヒドロピリド [ 3, 2 - d ] ピリミジニル (好ましくは、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロピリド [ 3, 2 - d ] ピリミジン - 3 - イル)、3 - テトラヒドロプテリジニル (好ましくは、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロプテリジン - 3 - イル) )、および

( b b ) ( i ) ハロゲン原子 (好ましくは、塩素原子)、

( i i ) シアノ基、

( i i i ) カルボキシ基、

( i v ) カルバモイル基、

( v ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ - カルボニル基 (好ましくは、メトキシカルボニル)、

( v i ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 (好ましくは、メチル) で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、トリアゾリル (好ましくは、1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル)、テトラゾリル (好ましくは、テトラゾール - 5 - イル) )、

( v i i ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、4, 5 - ジヒドロ - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル)、ジヒドロトリアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロトリアゾール - 3 - イル) )

から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好まし

くは、ジヒドロピリジル（好ましくは、1 - ジヒドロピリジル（好ましくは、1, 2 - ジヒドロピリジン - 1 - イル））、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））

から選択される1ないし4個（好ましくは1ないし3個、より好ましくは1または2個）の置換基で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基（好ましくは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル）、

(16)  $C_{1-6}$ アルコキシ基（好ましくは、メトキシ、エトキシ）、

(17)  $C_{1-6}$ アルキル - カルボニル基（好ましくは、アセチル）、

(18) - CO - NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>

[式中、

R<sup>P</sup>およびR<sup>Q</sup>は、それぞれ独立して、

(a) 水素原子、

(b) (i) ヒドロキシ基、

(ii)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基（好ましくは、メチルスルホニル）

、および

(iii)  $C_{1-6}$ アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）

から選択される1ないし3個（好ましくは、1個）の置換基で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基（好ましくは、メチル、エチル、イソブチル）、

(c)  $C_{1-6}$ アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）、

(d) カルボキシ基で置換されていてもよい $C_{6-12}$ アリール基（好ましくは、フェニル）、

(e)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基（好ましくは、メチルスルホニル）、または

(f) (i) 1ないし3個のハロゲン原子（好ましくは、フッ素原子）で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基（好ましくは、メチル）、および

(ii) 1ないし3個（好ましくは、1または2個）のハロゲン原子（好ましくは、フッ素原子）で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）

から選択される1ないし3個（好ましくは、1個）の置換基で置換されていてもよい $C_{6-12}$ アリールスルホニル基（好ましくは、フェニルスルホニル）を表す。]、

(19) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））で置換されていてもよい $C_{6-12}$ アリールオキシ基（好ましくは、フェノキシ）

、

(20) (a) シアノ基、

(b) カルボキシ基、

(c)  $C_{1-6}$ アルコキシ - カルボニル基（好ましくは、メトキシカルボニル）

、

(d) カルバモイル基、

(e) モノ - またはジ -  $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル基（好ましくは、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル）

（該 $C_{1-6}$ アルキルは、ヒドロキシ基で置換されていてもよい。）

(f)  $C_{1-6}$ アルキル基（好ましくは、メチル）で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、トリアゾリル（好ましくは、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル）、テトラゾリル（好ましくは、テトラゾール - 5 - イル））、および

(g) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル）、ジヒドロトリアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル））

から選択される1ないし3個（好ましくは、1個）の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環オキシ基（好ましくは、ピリジルオキシ（好ましくは、ピリジン - 3 - イルオキシ）

シ、ピリジン - 4 - イルオキシ) )、

( 2 1 ) カルボキシ基で置換されていてもよい芳香族複素環基 ( 好ましくは、チアゾリル ( 好ましくは、チアゾール 2 - イル ) )、または

( 2 2 ) ( a ) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )、および

( b ) オキシ基

で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロピリジル ( 好ましくは、1 , 2 - ジヒドロピリジン - 1 - イル )、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )

である。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 5 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 5 5】

式 ( I ) で表される化合物またはその塩 ( 以下、化合物 ( I ) と称する ) の好適な例としては、以下の化合物が挙げられる。

[ 化合物 ( I ) - 1 ]

環 A が、置換されていてもよいベンゼン環 [ 好ましくは、ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子、塩素原子 ) および C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 ( 好ましくは、メチル ) から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは 2 個 ) の置換基で置換されていてもよいベンゼン環 ] であり

R が、

( 1 ) ヒドロキシ基、

( 2 ) シアノ基、

( 3 ) カルボキシ基、

( 4 ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、エトキシカルボニル )、

( 5 ) アミノ基、

( 6 ) モノ - またはジ - C<sub>1</sub> - 6 アルキルアミノ基 ( 好ましくは、ジメチルアミノ )、

( 7 ) モノ - またはジ - C<sub>7</sub> - 1<sub>2</sub> アラルキルアミノ基 ( 好ましくは、ベンジルアミノ )

( 8 ) モノ - またはジ - ( C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル ) アミノ基 ( 好ましくは、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ )、

( 9 ) モノ - またはジ - ( C<sub>3</sub> - 6 シクロアルキルスルホニル ) アミノ基 ( 好ましくは、シクロプロピルスルホニルアミノ )、

( 1 0 ) モノ - またはジ - ( C<sub>6</sub> - 1<sub>2</sub> アリールスルホニル ) アミノ基 ( 好ましくは、フェニルスルホニルアミノ )、

( 1 1 ) モノ - またはジ - ( 芳香族複素環スルホニル ) アミノ基 ( 好ましくは、ピリジルスルホニルアミノ ( 好ましくは、ピリジン - 3 - イルスルホニルアミノ ) )、

( 1 2 ) - N R<sup>A</sup> - C O - R<sup>B</sup>

[ 式中、

R<sup>A</sup> は、

( a ) 水素原子、または

( b ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 ( 好ましくは、メチル ) を表し、

R<sup>B</sup> は、

( a ) ( i ) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子 )、

( i i ) ヒドロキシ基、

( i i i ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ )、

(iv) 芳香族複素環基 (好ましくは、トリアゾリル (好ましくは、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル))、および

(v) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル)、

(b)  $C_{3-6}$  シクロアルキル基 (好ましくは、シクロプロピル)、

(c)  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル基 (好ましくは、アセチル)、

(d) アミノ基、

(e) モノ -、またはジ -  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (好ましくは、メチルアミノ)、

(f) 環状アミノ基 (好ましくは、モルホリノ)、

(g) (i) シアノ基、

(ii) カルボキシ基、

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 (好ましくは、エトキシカルボニル)、

(iv)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ基 (好ましくは、メチルスルホニルアミノ)、および

(v) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリール基 (好ましくは、フェニル)、

(h) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)) で置換されていてもよい  $C_{7-12}$  アラルキル基 (好ましくは、ベンジル)、または

(i) 芳香族複素環基 (好ましくは、オキサゾリル (好ましくは、オキサゾール - 5 - イル)) を表す。]、

(13) -  $NR^C - SO_2 - N(R^D)(R^E)$

[式中、

$R^C$  は、

(a) 水素原子、または

(b)  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル) を表し、

$R^D$  および  $R^E$  は、それぞれ独立して、

(a) 水素原子、

(b)  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル)、または

(c)  $C_{3-6}$  シクロアルキル基 (好ましくは、シクロプロピル) を表す。]、

(14) 置換されていてもよい環状アミノ基 (好ましくは、

(a) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))、および

(b) オキソ基

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい環状アミノ基 (好ましくは、1 - イミダゾリジニル)、

(15) (a) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子)、

(b) シアノ基、

(c) ヒドロキシ基、

(d) カルボキシ基、

- ( e ) アミノ基、
- ( f ) カルバモイル基、
- ( g ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキル ) カルバモイル基 ( 好ましくは、イソプロピルカルバモイル ) ( 該  $C_{1-6}$  アルキルは、カルボキシ基で置換されていてもよい。 )、
- ( h ) モノ - またはジ - (  $C_{6-12}$  アリール ) カルバモイル基 ( 好ましくは、フェニルカルバモイル ) ( 該  $C_{6-12}$  アリールは、カルボキシ基で置換されていてもよい。 )、
- ( i ) ( i ) ヒドロキシ基、
  - ( i i ) カルボキシ基、
  - ( i i i ) カルバモイル基、
  - ( i v ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル ) アミノ基 ( 好ましくは、アセチルアミノ )、
  - ( v ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル ) アミノ基 ( 好ましくは、メチルスルホニルアミノ )、
  - ( v i )  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、エトキシカルボニル )、および
  - ( v i i ) ヒドロキシ基で置換されていてもよい環状アミノカルボニル基 ( 好ましくは、アゼチジン - 1 - イルカルボニル、1, 1 - ジオキシドチオモルホリノカルボニル )
 から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 または 2 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ )、
- ( j )  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニルオキシ基 ( 好ましくは、アセチルオキシ )、
- ( k )  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルオキシ基 ( 好ましくは、メチルスルホニルオキシ )、
- ( l ) ( i ) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子、塩素原子 )、
  - ( i i ) シアノ基、
  - ( i i i ) カルボキシ基、
  - ( i v )  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ )、
  - ( v )  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、メトキシカルボニル )、
  - ( v i )  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基 ( 好ましくは、メチルスルホニル )、
  - ( v i i ) モノ - またはジ - (  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル ) カルバモイル基 ( 好ましくは、メチルスルホニルカルバモイル )、
  - ( v i i i ) オキソ基またはチオキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )、および
  - ( i x ) ヒドロキシ基で置換されていてもよい環状アミノカルボニル基 ( 好ましくは、アゼチジン - 1 - イルカルボニル )
 から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 または 2 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールオキシ基 ( 好ましくは、フェノキシ )、
- ( m ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) ) で置換されていてもよい  $C_{7-12}$  アラルキルオキシ基 ( 好ましくは、ベンジルオキシ )、
- ( n ) ( i ) カルボキシ基、
  - ( i i )  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 ( 好ましくは、メトキシカルボニル )、および

( i i i ) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル ) ) から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 個 ) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環オキシ基 ( 好ましくは、ピリジルオキシ ( 好ましくは、ピリジン - 2 - イルオキシ ) )、

( o )  $C_{1-6}$  アルキルチオ基 ( 好ましくは、メチルチオ )、

( p ) カルボキシ基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールチオ基 ( 好ましくは、フェニルチオ )、

( q )  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基 ( 好ましくは、メチルスルフィニル )、

( r )  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基 ( 好ましくは、メチルスルホニル )、

( s ) ( i ) カルボキシ基、および

( i i ) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )

から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 個 ) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールスルホニル基 ( 好ましくは、フェニルスルホニル )、

( t ) モノ - またはジ -  $C_{1-6}$  アルキルスルファモイル基 ( 好ましくは、イソプロピルスルファモイル )、

( u ) ( i ) カルボキシ基、および

( i i ) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 ( 好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル ( 好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) )

から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 個 ) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環アミノ基 ( 好ましくは、ピリジルアミノ ( 好ましくは、ピリジン - 2 - イルアミノ )、ピリミジニルアミノ ( 好ましくは、ピリミジン - 2 - イルアミノ )、ベンゾオキサゾリルアミノ ( 好ましくは、ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ ) )、

( v ) -  $NR^F - CO - R^G$

[ 式中、

$R^F$  は、

( i ) 水素原子、または

( i i ) ヒドロキシ基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 ( 好ましくは、メチル、エチル ) を表し、

$R^G$  は、

( i ) (1) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子 )、

(2) シアノ基、

(3) ヒドロキシ基、

(4) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子 ) および  $C_{3-6}$  シクロアルキル基 ( 好ましくは、シクロプロピル ) から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ( 好ましくは、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、イソブトキシ )、

(5)  $C_{3-6}$  シクロアルキルオキシ基 ( 好ましくは、シクロプロピルオキシ )、

(6) ハロゲン原子 ( 好ましくは、フッ素原子、塩素原子 )、シアノ基およびカルボキシ基から選択される 1 ないし 3 個 ( 好ましくは、1 個 ) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環オキシ基 ( 好ましくは、ピリジルオキシ ( 好ましくは、ピリジン - 2 - イルオキシ )、ピリミジニルオキシ ( 好ましくは、ピリミジン - 2 - イルオキシ ) )、

(7) モノ - またはジ -  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 ( 好ましくは、メチルアミノ、ジメチルアミノ )、

(8) N - (C<sub>1</sub> - 6 アルキル - カルボニル) - N - (C<sub>1</sub> - 6 アルキル) アミノ基 (好ましくは、N - アセチル - N - メチルアミノ)、

(9) モノ - またはジ - (C<sub>6</sub> - 1<sub>2</sub> アリール - カルボニル) アミノ基 (好ましくは、ベンゾイルアミノ)、

(10) モノ - またはジ - (芳香族複素環カルボニル) アミノ基 (好ましくは、ピリジルカルボニルアミノ (好ましくは、ピリジン - 2 - イルカルボニルアミノ))、

(11) N - (芳香族複素環カルボニル) - N - (C<sub>1</sub> - 6 アルキル) アミノ基 (好ましくは、N - (ピリジルカルボニル) - N - メチルアミノ (好ましくは、N - (ピリジン - 2 - イルカルボニル) - N - メチルアミノ))、

(12) モノ - またはジ - (C<sub>6</sub> - 1<sub>2</sub> アリールスルホニル) アミノ基 (好ましくは、フェニルスルホニルアミノ)、

(13) C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオ基 (好ましくは、メチルチオ)、

(14) C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル基 (好ましくは、メチルスルホニル)、

(15) C<sub>1</sub> - 6 アルキル - カルボニルオキシ基 (好ましくは、アセチルオキシ)、

(16) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))、およびカルボキシ基から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい C<sub>6</sub> - 1<sub>2</sub> アリールオキシ基 (好ましくは、フェノキシ)、

(17) カルボキシ基および C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 (好ましくは、メチル) から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、ピリジル (好ましくは、ピリジン - 2 - イル)、ピラゾリル (好ましくは、ピラゾール - 1 - イル)、イソオキサゾリル (好ましくは、イソオキサゾール - 5 - イル)、トリアゾリル (好ましくは、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)、テトラゾリル (好ましくは、テトラゾール - 1 - イル))、

(18) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子、塩素原子) およびオキシ基から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい環状アミノ基 (好ましくは、1 - ピロリジニル、ピペリジノ、1 - イミダゾリジニル、モルホリノ、8 - オキサ - 3 - アザビシクロ [3.2.1] オクタン - 3 - イル)、および

(19) ハロゲン原子 (好ましくは、塩素原子) およびオキシ基から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロピリジル (好ましくは、1, 2 - ジヒドロピリジン - 1 - イル)、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル)、

(i i) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ、イソプロポキシ)

(i i i) C<sub>3</sub> - 6 シクロアルキル基 (好ましくは、シクロプロピル)、

(i v) (1) ハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子、塩素原子)、

(2) シアノ基、

(3) ヒドロキシ基、

(4) カルボキシ基、

(5) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)) で置換されていてもよい C<sub>1</sub> - 6 アルキル基 (好ましくは、メチ

ル、tert-ブチル)、

(6) C<sub>1-6</sub> アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ、エトキシ)、

(7) C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル基 (好ましくは、メチルスルホニル)、

(8) モノ-またはジ- (C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル) アミノ基 (好ましくは、メチルスルホニルアミノ)、

(9) C<sub>6-12</sub> アリール基 (好ましくは、フェニル)、

(10) C<sub>1-6</sub> アルキル基 (好ましくは、メチル) で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、オキサジアゾリル (好ましくは、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)、テトラゾリル (好ましくは、テトラゾール-5-イル))

、

(11) オキソ基で置換されていてもよい環状アミノ基 (好ましくは、1-ピロリジニル)、および

(12) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5-ジヒドロ-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル))

から選択される1ないし3個の置換基で置換されていてもよいC<sub>6-12</sub> アリール基 (好ましくは、フェニル)、

(v) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5-ジヒドロ-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)) で置換されていてもよいC<sub>7-12</sub> アラルキル基 (好ましくは、ベンジル)、

(vi) (1) C<sub>1-6</sub> アルキル基 (好ましくは、メチル)、

(2) モノ-またはジ- (C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル) アミノ基 (好ましくは、メチルスルホニルアミノ)、および

(3) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5-ジヒドロ-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル))

から選択される1ないし3個 (好ましくは、1個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、ピリジル (好ましくは、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル)、チアゾリル (好ましくは、チアゾール-5-イル))、

(vii) 1または2個のオキソ基で置換されていてもよい環状アミノ基 (好ましくは、1-ピロリジニル、モルホリノ、1, 1-ジオキシドチオモルホリノ)、

(viii) 1または2個のオキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロピリジル (好ましくは、1, 2-ジヒドロピリジン-3-イル)、テトラヒドロフリル (好ましくは、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル)、テトラヒドロピラニル (好ましくは、テトラヒドロピラン-2-イル、テトラヒドロピラン-4-イル)、ジオキサニル (好ましくは、1, 4-ジオキサニル-2-イル))、

(ix) C<sub>1-6</sub> アルキル-カルボニル基 (好ましくは、アセチル、エチルカルボニル)、または

(x) 環状アミノカルボニル基 (好ましくは、ピロリジン-1-イルカルボニル) を表す。]、

(w) -NR<sup>H</sup>-SO<sub>2</sub>-R<sup>I</sup>

[式中、

R<sup>H</sup> は、

(i) 水素原子、

(ii) C<sub>1-6</sub> アルキル基 (好ましくは、メチル)、または

(iii) C<sub>1-6</sub> アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) で置換されていてもよいC<sub>7-12</sub> アラルキル基 (好ましくは、ベンジル) を表し、

$R^I$  は、

- (i) (1) ハロゲン原子（好ましくは、フッ素原子）、
- (2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）、および
- (3) 環状アミノ基（好ましくは、モルホリノ）

から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル、エチル、イソプロピル）、

(ii) (1) カルボキシ基、および

(2) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））

から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 個）の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリール基（好ましくは、フェニル）、または

(iii) (1) カルボキシ基、および

(2) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））

から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 個）の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、ピリジル（好ましくは、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル）、フリル（好ましくは、フラン - 2 - イル））を表す。 ]、

(x) -  $NR^J - CO - NR^K R^L$

[ 式中、

$R^J$  は、

(i) 水素原子、または

(ii) ヒドロキシ基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル、エチル）を表し、

$R^K$  および  $R^L$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子、

(ii) ヒドロキシおよび  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 個）の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル、エチル、tert - ブチル）、または

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）

を表す。 ]、

(y) -  $NR^M - SO_2 - NR^N R^O$

[ 式中、

$R^M$  は、

(i) 水素原子、または

(ii)  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル）を表し、

$R^N$  および  $R^O$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子、

(ii)  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル）、または

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）を表す。 ]、

(z) (i) カルボキシ基、

(ii) ハロゲン原子（好ましくは、フッ素原子）、ヒドロキシ基およびカルボキシ基から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基（好ましくは、メチル）、

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、メトキシ）で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基（好ましくは、エトキシ、tert - ブトキシ）、

(iv)  $C_{3-6}$  シクロアルキル基（好ましくは、シクロプロピル）、および

(v) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジ

ヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル）

から選択される 1 ないし 3 個（好ましくは、1 または 2 個）の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、ピラゾリル（好ましくは、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル）、オキサジアゾリル（好ましくは、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル）、チアゾリル（好ましくは、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル）、トリアゾリル（好ましくは、1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル）、インダゾリル（好ましくは、1 H - インダゾール - 1 - イル）、ベンゾイミダゾリル（好ましくは、1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル））、

( a a ) ( i ) シアノ基、

( i i ) カルボキシ基、

( i i i ) C<sub>1-6</sub> アルキル基（好ましくは、メチル）、

( i v ) C<sub>1-6</sub> アルコキシ - カルボニル基（好ましくは、エトキシカルボニル）、

( v ) モノ - またはジ - ( C<sub>1-6</sub> アルキル - カルボニル ) アミノ基（好ましくは、アセチルアミノ）、

( v i ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））、および

( v i i ) オキソ基

から選択される 1 ないし 4 個の置換基で置換されていてもよい環状アミノ基（好ましくは、1 - アゼチジニル、1 - ピロリジニル、ピペリジノ、1 - イミダゾリジニル、1 - ジヒドロピリダジニル（好ましくは、2, 3 - ジヒドロピリダジン - 2 - イル）、1 - ヘキサヒドロピリミジニル、2 - ジヒドロイソインドリル（好ましくは、1, 3 - ジヒドロ - 2 H - イソインドール - 2 - イル）、3 - ジヒドロキナゾリニル（好ましくは、3, 4 - ジヒドロキナゾリン - 3 - イル）、3 - テトラヒドロキナゾリニル（好ましくは、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキナゾリン - 3 - イル）、3 - テトラヒドロピリド [ 3, 2 - d ] ピリミジニル（好ましくは、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロピリド [ 3, 2 - d ] ピリミジン - 3 - イル）、3 - テトラヒドロプテリジニル（好ましくは、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロプテリジン - 3 - イル））、および

( b b ) ( i ) ハロゲン原子（好ましくは、塩素原子）、

( i i ) シアノ基、

( i i i ) カルボキシ基、

( i v ) カルバモイル基、

( v ) C<sub>1-6</sub> アルコキシ - カルボニル基（好ましくは、メトキシカルボニル）、

( v i ) C<sub>1-6</sub> アルキル基（好ましくは、メチル）で置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、トリアゾリル（好ましくは、1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル）、テトラゾリル（好ましくは、テトラゾール - 5 - イル））、

( v i i ) オキソ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、4, 5 - ジヒドロ - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル）、ジヒドロトリアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロトリアゾール - 3 - イル）

から選択される 1 ないし 3 個の置換基で置換されていてもよい非芳香族複素環基（好ましくは、ジヒドロピリジル（好ましくは、1 - ジヒドロピリジル（好ましくは、1, 2 - ジヒドロピリジン - 1 - イル））、ジヒドロオキサジアゾリル（好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル））

から選択される 1 ないし 4 個（好ましくは 1 ないし 3 個、より好ましくは 1 または 2 個）の置換基で置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> アルキル基（好ましくは、メチル、エチル、ブ

ロピル、イソプロピル)、

(16)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ、エトキシ)、

(17)  $C_{1-6}$  アルキル - カルボニル基 (好ましくは、アセチル)、

(18) -CO-NR<sup>P</sup>R<sup>Q</sup>

[ 式中、

R<sup>P</sup> および R<sup>Q</sup> は、それぞれ独立して、

(a) 水素原子、

(b) (i) ヒドロキシ基、

(ii)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基 (好ましくは、メチルスルホニル)

、および

(iii)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ)

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル、エチル、イソブチル)、

(c)  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ)、

(d) カルボキシ基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリール基 (好ましくは、フェニル)、

(e)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基 (好ましくは、メチルスルホニル)、または

(f) (i) 1 ないし 3 個のハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子) で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル)、および

(ii) 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) のハロゲン原子 (好ましくは、フッ素原子) で置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ)

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールスルホニル基 (好ましくは、フェニルスルホニル) を表す。]

(19) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)) で置換されていてもよい  $C_{6-12}$  アリールオキシ基 (好ましくは、フェノキシ)

(20) (a) シアノ基、

(b) カルボキシ基、

(c)  $C_{1-6}$  アルコキシ - カルボニル基 (好ましくは、メトキシカルボニル)

(d) カルバモイル基、

(e) モノ - または ジ -  $C_{1-6}$  アルキルカルバモイル基 (好ましくは、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル)

(該  $C_{1-6}$  アルキルは、ヒドロキシ基で置換されていてもよい。)、

(f)  $C_{1-6}$  アルキル基 (好ましくは、メチル) で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、トリアゾリル (好ましくは、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル)、テトラゾリル (好ましくは、テトラゾール - 5 - イル))、および

(g) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)、ジヒドロトリアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル))

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 個) の置換基で置換されていてもよい芳香族複素環オキシ基 (好ましくは、ピリジルオキシ (好ましくは、ピリジン - 3 - イルオキシ、ピリジン - 4 - イルオキシ))、

(21) カルボキシ基で置換されていてもよい芳香族複素環基 (好ましくは、チアゾリル (好ましくは、チアゾール 2 - イル))、または

(22) (a) オキシ基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール -

3 - イル) )、および

(b) オキシ基

から選択される 1 ないし 3 個 (好ましくは、1 または 2 個) の置換基で置換されていてもよい非芳香族複素環基 (好ましくは、ジヒドロピリジル (好ましくは、1, 2 - ジヒドロピリジン - 1 - イル)、ジヒドロオキサジアゾリル (好ましくは、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) )

であり、

環 B<sup>1</sup> ~ B<sup>6</sup> が、環 A および R 以外に、ヒドロキシ基または C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) で置換されていてもよい、化合物 (I)。

[化合物 (I) - 1']

環 B<sup>1</sup> ~ B<sup>6</sup> が、環 A および R 以外に置換基を有していない、化合物 (I)。

[化合物 (I) - 1'']

環 B<sup>1</sup> ~ B<sup>6</sup> が、環 A および R 以外に、ヒドロキシ基または C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 (好ましくは、メトキシ) で置換されている、化合物 (I)。

【**手続補正 4**】

【**補正対象書類名**】明細書

【**補正対象項目名**】0313

【**補正方法**】変更

【**補正の内容**】

【0313】

[化合物 (IIf<sup>25</sup>), (IIf<sup>26</sup>), (IIf<sup>27</sup>) およびその誘導体の製造法]

化合物 (IIf) に含まれる化合物 (IIf<sup>25</sup>) (R は、-CHO)、化合物 (IIf<sup>26</sup>) (R は、-CO<sub>2</sub>H)、および化合物 (IIf<sup>27</sup>) (R は、-NH<sub>2</sub>) は、例えば以下の方法により製造することができる。