

【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7月13日(2006.7.13)

【公表番号】特表2005-529180(P2005-529180A)

【公表日】平成17年9月29日(2005.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2005-038

【出願番号】特願2004-513236(P2004-513236)

【国際特許分類】

C 0 7 C 235/66	(2006.01)
A 6 1 K 31/198	(2006.01)
A 6 1 K 31/381	(2006.01)
A 6 1 K 31/40	(2006.01)
A 6 1 K 31/405	(2006.01)
A 6 1 K 31/4164	(2006.01)
A 6 1 K 31/437	(2006.01)
A 6 1 K 31/4402	(2006.01)
A 6 1 K 31/4406	(2006.01)
A 6 1 K 31/4409	(2006.01)
A 6 1 K 31/4453	(2006.01)
A 6 1 K 31/5375	(2006.01)
A 6 1 P 7/04	(2006.01)
A 6 1 P 9/02	(2006.01)
A 6 1 P 13/00	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
C 0 7 C 237/48	(2006.01)
C 0 7 C 311/08	(2006.01)
C 0 7 D 209/20	(2006.01)
C 0 7 D 213/30	(2006.01)
C 0 7 D 213/55	(2006.01)
C 0 7 D 213/89	(2006.01)
C 0 7 D 233/60	(2006.01)
C 0 7 D 295/08	(2006.01)
C 0 7 D 295/12	(2006.01)
C 0 7 D 333/24	(2006.01)
C 0 7 D 471/04	(2006.01)

【F I】

C 0 7 C 235/66	C S P
A 6 1 K 31/198	
A 6 1 K 31/381	
A 6 1 K 31/40	
A 6 1 K 31/405	
A 6 1 K 31/4164	
A 6 1 K 31/437	
A 6 1 K 31/4402	
A 6 1 K 31/4406	
A 6 1 K 31/4409	
A 6 1 K 31/4453	
A 6 1 K 31/5375	

A 6 1 P 7/04  
 A 6 1 P 9/02  
 A 6 1 P 13/00  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 C 237/48  
 C 0 7 C 311/08  
 C 0 7 D 209/20  
 C 0 7 D 213/30  
 C 0 7 D 213/55  
 C 0 7 D 213/89  
 C 0 7 D 233/60 1 0 3  
 C 0 7 D 295/08 Z  
 C 0 7 D 295/12 Z  
 C 0 7 D 333/24  
 C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年5月29日(2006.5.29)

## 【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

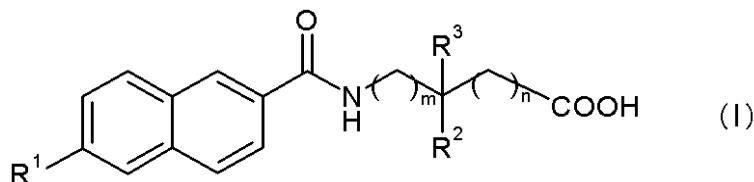
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)：

## 【化1】



式中、

mおよびnは、独立して0ないし2の整数を表し；

-R<sup>1</sup>は、-O-R<sup>1</sup><sub>0</sub>-OR<sup>1</sup><sub>1</sub>、-OR<sup>1</sup><sub>1</sub>、-SR<sup>1</sup><sub>1</sub>、-S(O)R<sup>1</sup><sub>1</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>1</sub>、-NR<sup>1</sup><sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>3</sub>または-CHR<sup>1</sup><sub>4</sub>R<sup>1</sup><sub>5</sub>を表し

[ここで、-R<sup>1</sup><sub>0</sub>-は、(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>)アルキレンを表し；

R<sup>1</sup><sub>1</sub>は、アリール、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある(C<sub>2</sub>-<sub>6</sub>)アルケニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある(C<sub>2</sub>-<sub>6</sub>)アルキニル、または(C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>)シクロアルキル、アリールもしくは4ないし9個の炭素およびヘテロ原子として少なくとも1個のN、OもしくはSを含むヘテロ環により置換されていることもある(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>)アルキルであり(ここで、該(C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>)シクロアルキル、アリールおよびヘテロ環は、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、モノ-、ジ-またはトリ-ハロゲンにより置換されていることもある(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>)アルキル、および(C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>)シクロアルキルまたはモノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲンにより置換されていることもあります(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>)アルコキシからなる群から選択される1個または2個の置換基を有することもある)；

R<sup>1</sup><sub>2</sub>およびR<sup>1</sup><sub>3</sub>は、独立して、水素を表すか、または、アリールもしくはヘテロアリ

ールにより置換されていることもある (C<sub>2</sub>~6) アルケニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある (C<sub>2</sub>~6) アルキニル、またはアリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある (C<sub>1</sub>~6) アルキルを表すか、または、

R<sup>1~2</sup> および R<sup>1~3</sup> は、窒素原子と一緒にになって、O または NH により中断されていることもある 5 ないし 7 員の飽和ヘテロ環を形成し；

R<sup>1~4</sup> および R<sup>1~5</sup> は、独立して、水素を表すか、または、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある (C<sub>2</sub>~6) アルケニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもあります (C<sub>2</sub>~6) アルキニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルキル、またはアリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルコキシを表すか、または、

R<sup>1~4</sup> および R<sup>1~5</sup> は、CH と一緒にになって、NH もしくは O により中断されていることもあります (C<sub>3</sub>~8) シクロアルキル、またはヒドロキシ、ハロゲンもしくは (C<sub>1</sub>~6) アルキルにより置換されていることもありますフェニルを形成する]；

R<sup>2</sup> は、水素、ヒドロキシ、シアノ、(C<sub>1</sub>~6) アルコキシ、(C<sub>2</sub>~6) アルケニル、(C<sub>2</sub>~6) アルキニル、(C<sub>3</sub>~7) シクロアルキルを表すか、またはヒドロキシ、アミノ、(C<sub>1</sub>~6) アルキルアミノ、アリールおよび 4 ないし 10 個の炭素およびヘテロ原子として少なくとも 1 個の N、O または S を含むヘテロアリールからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある (C<sub>1</sub>~6) アルキルを表し (ここで、該アリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N ((C<sub>1</sub>~6) アルキルスルホニル) アミノ、モルホリノ、フェニル、ピリジル、モノ-、ジ- またはトリ- ハロゲンにより置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルコキシ、およびモノ-、ジ- またはトリ- ハロゲンにより置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルキルからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある)；そして、

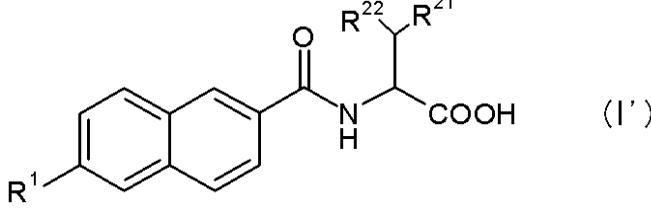
R<sup>3</sup> は、水素または (C<sub>1</sub>~6) アルキルを表す、

の 2 - ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

### 【請求項 2】

式 (I') :

### 【化 2】



式中、

- R<sup>1</sup> は、- O - R<sup>1~0</sup> - O R<sup>1~1</sup>、- O R<sup>1~1</sup>、- S R<sup>1~1</sup>、- S O R<sup>1~1</sup>、- S O<sub>2</sub> R<sup>1~1</sup>、- N R<sup>1~2</sup> R<sup>1~3</sup> または - C H R<sup>1~4</sup> R<sup>1~5</sup> を表し

[ここで、- R<sup>1~0</sup> - は、(C<sub>1</sub>~6) アルキレンを表し；

R<sup>1~1</sup> は、アリール、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもあります (C<sub>2</sub>~6) アルケニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもあります (C<sub>2</sub>~6) アルキニル、または (C<sub>3</sub>~8) シクロアルキル、アリールもしくは 4 ないし 9 個の炭素およびヘテロ原子として少なくとも 1 個の N、O または S を含むヘテロ環により置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルキルであり (ここで、該 (C<sub>3</sub>~8) シクロアルキル、アリールおよびヘテロ環は、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、モノ-、ジ- またはトリ- ハロゲンにより置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルキル、および (C<sub>3</sub>~8) シクロアルキルまたはモノ-、ジ- もしくはトリ- ハロゲンにより置換されていることもあります (C<sub>1</sub>~6) アルコキシからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある)；

$R^{1-2}$  および  $R^{1-3}$  は、独立して、水素を表すか、または、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルケニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルキニル、またはアリールもしくはヘテロアリールにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルキルを表すか、または、

$R^{1-2}$  および  $R^{1-3}$  は、窒素原子と一緒にになって、O または NH により中断されていることもある 5 ないし 7 員の飽和ヘテロ環を形成し；

$R^{1-4}$  および  $R^{1-5}$  は、独立して、水素を表すか、または、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されているもある ( $C_{2-6}$ ) アルケニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されているもある ( $C_{2-6}$ ) アルキニル、アリールもしくはヘテロアリールにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルキル、またはアリールもしくはヘテロアリールにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルコキシを表すか、または、

$R^{1-4}$  および  $R^{1-5}$  は、CH と一緒にになって、NH もしくは O により中断されていることもある ( $C_{3-8}$ ) シクロアルキル、またはヒドロキシ、ハロゲンもしくは ( $C_{1-6}$ ) アルキルにより置換されているもあるフェニルを形成する]、

$R^{2-1}$  は、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、チエニル、ピリジル、フェニル、ナフチル、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル、またはハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されているもあるインドリルを表し（ここで、該フェニルおよびナフチルは、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N(( $C_{1-6}$ ) アルキル)アミノ、ジ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、N(( $C_{1-6}$ ) アルキルスルホニル)アミノ、モルホリノ、フェニル、ピリジル、モノ-、ジ-またはトリ-ハロゲンにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルコキシ、およびモノ-、ジ-またはトリ-ハロゲンにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルキルからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある）；そして、

$R^{2-2}$  は、水素またはヒドロキシを表す、

の 2-ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

#### 【請求項 3】

式中、

$R^1$  が、フェノキシを表すか、シクロプロピル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピペリジニル、イミダゾリル、ピリジル、ピロリル、( $C_{1-6}$ ) アルキルにより置換されているもあるチアゾリル、またはフェニルにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルコキシを表す（ここで、該フェニルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、ヒドロキシ、モノ-、ジ-またはトリ-ハロゲンにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルキル、およびモノ-、ジ-またはトリ-ハロゲン、シクロプロピルまたはシクロヘキシルにより置換されているもある ( $C_{1-6}$ ) アルコキシからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある）、

請求項 1 または請求項 2 に記載の 2-ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

#### 【請求項 4】

式中、

$R^1$  が、フェノキシ ( $C_{1-6}$ ) アルキル、フェノキシ ( $C_{1-6}$ ) アルケニル、フェノキシ ( $C_{1-6}$ ) アルキニルまたはフェニル ( $C_{1-6}$ ) アルコキシを表す、

請求項 1 または請求項 2 に記載の 2-ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

#### 【請求項 5】

式中、

$R^2$  が、フェニル ( $C_{1-6}$ ) アルキルを表す（ここで、該フェニルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N(メタンスルホニル)アミノ、モルホリノ、フェニル、ピリジル、メトキシ、エトキシおよびトリフルオロメチルからなる

群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある）、  
請求項 1 に記載の 2 - ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれ  
らの塩。

#### 【請求項 6】

式中、

$R^1$  が、フェノキシを表すか、シクロプロピル、シクロヘキシリル、ピロリジニル、ピペリジニル、イミダゾリル、ピリジル、ピロリル、フェニルまたは (C<sub>1</sub> - 6) アルキルにより置換されていることもあるチアゾリルにより置換されていることもある (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシを表し（ここで、該フェニルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、ヒドロキシ、モノ - 、ジ - またはトリ - ハロゲンにより置換されていることもある (C<sub>1</sub> - 6) アルキル、およびモノ - 、ジ - またはトリ - ハロゲン、シクロプロピルまたはシクロヘキシリルにより置換されているもある (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある）；

$R^2$  が、シアノ、チエニル、ピリジル、フェニル、ナフチル、1H - ピロロ [2,3 - b] ピリジン - 3 - イル、またはハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていること  
もあるインドリルを表し（ここで、該フェニルおよびナフチルは、フルオロ、クロロ、ブ  
ロモ、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N ((C<sub>1</sub> - 6) アルキル) アミノ、ジ (C<sub>1</sub> - 6  
) アルキルアミノ、N ((C<sub>1</sub> - 6) アルキルスルホニル) アミノ、モルホリノ、フェニ  
ル、ピリジル、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルオキシ、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキ  
シおよび (C<sub>1</sub> - 6) アルキルからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有す  
る）；そして、

$R^2$  が、水素またはヒドロキシを表す、

請求項 2 に記載の 2 - ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれ  
らの塩。

#### 【請求項 7】

式中、

$R^1$  および  $R^1$  が、独立して、水素、または、フェニル、ナフチルもしくはピリジル  
により置換されていることもある (C<sub>1</sub> - 6) アルキルを表す、

請求項 1 または請求項 2 に記載の 2 - ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性  
体、またはそれらの塩。

#### 【請求項 8】

該誘導体が、以下の化合物からなる群から選択される、請求項 1 に記載の 2 - ナフトア  
ミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩：

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] フェニルアラニン；

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニ  
ルアラニン；

N - {6 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；

N - {6 - [(3 - フルオロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；

N - {6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；

N - [6 - (3 - ピリジニルメトキシ) - 2 - ナフトイル] フェニルアラニン；

N - {6 - [(3,4 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラ  
ニン；

N - {6 - [2 - (1H - ピロル - 1 - イル) エトキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルア  
ラニン；

N - [6 - (4 - ピリジニルメトキシ) - 2 - ナフトイル] フェニルアラニン；

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - (トリフルオロメチル) フェニ  
ルアラニン；

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] トリプトファン；

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - O - メチルチロシン；

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - メトキシチロシン；

N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - - ヒドロキシフェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (2 - フェニルエトキシ) - 2 - ナフトイル] フェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 4 - クロロフェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - フルオロフェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (2 - クロロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3 - クロロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (2 - メトキシベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3 - メトキシベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (2,3 - ジクロロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3,5 - ジクロロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3,5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - (2 - チエニル) アラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 4 - ブロモフェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 4 - ニトロフェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - ヒドロキシフェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - (1 - ナフチル) アラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 5 - ヒドロキシトリプトファン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 2 - フルオロフェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (2 - ブロモベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3 - ブロモベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (2 - メチルベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3 - メチルベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3 - ニトロベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - (2 - ナフチル) アラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 4 - ヨードフェニルアラニン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 5 - フルオロトリプトファン；  
 N - [ 6 - (ベンジルオキシ) - 2 - ナフトイル] - 3 - (1H - ピロロ[2,3-b]ピリジン - 3 - イル) アラニン；  
 N - { 6 - [ 2 - (4 - ピリジニル) エトキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 N - { 6 - [ (3 - エトキシベンジル) オキシ] - 2 - ナフトイル} フェニルアラニン；  
 および  
 N - [ 6 - (2 - フェニルプロポキシ) - 2 - ナフトイル] フェニルアラニン。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の 2 - ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの生理的に許容し得る塩を有効成分として含む、医薬。

【請求項 10】

1 またはそれ以上の医薬的に許容し得る賦形剤をさらに含む、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 11】

2 - ナフトアミド誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの生理的に許容し得る塩が、IP 受容体アンタゴニストである、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 12】

泌尿器系障害または疾患の予防および／または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 13】

疼痛の予防および／または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 14】

低血圧の予防および／または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 15】

血友病および出血の予防および／または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 16】

炎症の予防および／または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 17】

泌尿器系障害の処置および／または予防のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 18】

疼痛の処置および／または予防のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 19】

低血圧の処置および／または予防のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 20】

血友病および出血の処置および／または予防のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 21】

炎症の処置および／または予防のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 22】

IP 受容体アンタゴニスト的に有効な量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物を投与することによる、ヒトおよび動物における泌尿器系障害の制御方法。

【請求項 23】

IP 受容体アンタゴニスト的に有効な量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物を投与することによる、ヒトおよび動物における疼痛の制御方法。

【請求項 24】

IP 受容体アンタゴニスト的に有効な量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物を投与することによる、ヒトおよび動物における低血圧の制御方法。

【請求項 25】

IP 受容体アンタゴニスト的に有効な量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物を投与することによる、ヒトおよび動物における血友病および出血の制御方法。

【請求項 26】

IP 受容体アンタゴニスト的に有効な量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物を投与することによる、ヒトおよび動物における炎症の制御方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

式 (I) または (I') の化合物のさらに別の実施態様は、式中、  
R<sup>1</sup> が、フェノキシを表すか、シクロプロピル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピペリジニル、イミダゾリル、ピリジル、ピロリル、フェニル、または (C<sub>1</sub> - 6) アルキルにより置換されていることもあるチアゾリルにより置換されていることもある (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシを表す (ここで、該フェニルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、ヒドロキシ、モノ-、ジ- またはトリ- ハロゲンにより置換されていることもある (C<sub>1</sub> - 6) アルキル、およびモノ-、ジ- またはトリ- ハロゲン、シクロプロピルまたはシクロヘキシルにより置換されているもある (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシからなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基を有することもある)、  
ものである。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0026

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0026】

式(I')の化合物のさらなる実施態様は、式中、

R<sup>1</sup>が、フェノキシを表すか、シクロプロピル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピペリジニル、イミダゾリル、ピリジル、ピロリル、フェニル、または(C<sub>1</sub>~6)アルキルにより置換されていることもあるチアゾリルにより置換されていることもある(C<sub>1</sub>~6)アルコキシを表し（ここで、該フェニルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、ヒドロキシ、モノ-、ジ-またはトリ-ハロゲンにより置換されていることもある(C<sub>1</sub>~6)アルキル、およびモノ-、ジ-またはトリ-ハロゲン、シクロプロピルまたはシクロヘキシルにより置換されているもある(C<sub>1</sub>~6)アルコキシからなる群から選択される1個または2個の置換基を有することもある）；

R<sup>2</sup><sup>1</sup>が、シアノ、チエニル、ピリジル、フェニル、ナフチル、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル、またはハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていることもあるインドリルを表し（ここで、該フェニルおよびナフチルは、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N((C<sub>1</sub>~6)アルキル)アミノ、ジ(C<sub>1</sub>~6)アルキルアミノ、N((C<sub>1</sub>~6)アルキルスルホニル)アミノ、モルホリノ、フェニル、ピリジル、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルオキシ、(C<sub>1</sub>~6)アルコキシおよび(C<sub>1</sub>~6)アルキルからなる群から選択される1個または2個の置換基を有する）；そして、

R<sup>2</sup><sup>2</sup>が、水素またはヒドロキシを表す、  
ものである。