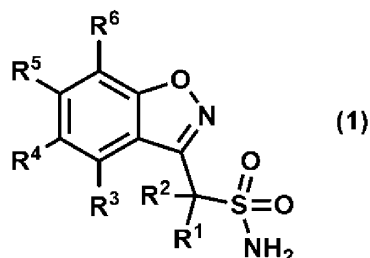


請求の範囲

[請求項1] 式(1)で表される化合物、又はその製薬学的に許容される塩。

[化1]



[式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又は C_{3-6} シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、

R^2 は、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又は C_{3-6} シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表すか、あるいは

R^1 及び R^2 はそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-6} シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を構成した基を表し、

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して

選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、 C_{3-6} シクロアルキル(該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、又は C_{1-6} アルコキシ(該アルコキシはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)を表す。]

[請求項2]

R^1 が、水素、フッ素、 C_{1-6} アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、又は C_{3-6} シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)であり、

R^2 が、フッ素、 C_{1-6} アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、又は C_{3-6} シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)であるか、あるいは

R^1 及び R^2 がそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-6} シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)を構成した基である、

請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

[請求項3]

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_{1-6} アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、 C_{3-6} シクロ

アルキル（該シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又は C_{1-6} アルコキシ（該アルコキシはフッ素、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）である、

請求項1または2に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

[請求項4]

R^1 が、水素、フッ素、又は C_{1-6} アルキル（該アルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）であり、

R^2 が、フッ素、又は C_{1-6} アルキル（該アルキルはフッ素、水酸基及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）であるか、あるいは

R^1 及び R^2 がそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-6} シクロアルキル（該シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を構成した基である、

請求項1～3のいずれかに記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

[請求項5]

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が、同一又は異なって、水素、ハロゲン、又は C_{1-3} アルコキシ（該アルコキシは、1～3個のフッ素で置換されていてもよい）である、

請求項1～4のいずれかに記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

[請求項6]

R^1 が、水素、フッ素、又は C_{1-6} アルキル（該アルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）であり、

R^2 が、フッ素、又は C_{1-6} アルキル（該アルキルはフッ素、水酸

基及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい)であるか、あるいは

R¹及びR²がそれらが結合する炭素原子と一緒にあってC₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい)を構成した基であり、

R³、R⁴、R⁵及びR⁶が、同一又は異なって、水素、ハロゲン、又はC₁₋₃アルコキシ(該アルコキシは、1～3個のフッ素で置換されていてもよい)である、

請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

[請求項7]

以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩：

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド、

2-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)プロパン-2-スルホンアミド、

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)-1-フルオロメタンスルホンアミド、

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)-1,1-ジフルオロメタンスルホンアミド、

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)シクロプロパン-1-スルホンアミド、

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)プロパン-1-スルホンアミド、

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)ブタン-1-スルホンアミド、

1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)-1-フルオロエタン-1-スルホンアミド、

1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) - 2-メチルプロパン-1-スルホンアミド、

1 - (5-メトキシ-1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド、

1 - (5-フルオロ-1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド、

1 - (5-クロロ-1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド、

(1 R) - 1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド、または

(1 S) - 1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド。

[請求項8]

以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩：

1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド、

2 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) プロパン-2-スルホンアミド、

1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) - 1-フルオロメタン-スルホンアミド、

1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) - 1, 1-ジフルオロメタン-スルホンアミド、

1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) シクロプロパン-1-スルホンアミド、

1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) - 1-フルオロエタン-1-スルホンアミド、

(1 R) - 1 - (1, 2-ベンゾオキサゾール-3-イル) エタン-1-スルホンアミド、または

(1 S) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

[請求項9] 以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩：

1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド、

2 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) プロパン - 2 - スルホンアミド、

1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) シクロプロパン - 1 - スルホンアミド、

(1 R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド、または

(1 S) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

[請求項10] 請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物、又はその製薬学的に許容される塩を含有する医薬組成物。

[請求項11] 請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物、又はその製薬学的に許容される塩を有効成分として含有する、T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患又は精神疾患の治療剤および／又は予防剤。

[請求項12] T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患または精神疾患が、てんかん、発作性疾患、運動機能異常（痙攣を含む筋肉痙攣に関連する障害、振戦、本態性振戦、ハンチントン舞踏病、ミオクローヌス、チック、下肢静止不能症候群及びジストニー）、無動症及び硬直症候群を含む運動障害およびパーキンソニズム（パーキンソン病（振戦、筋硬直・筋固縮、無動・寡動、姿勢反射障害、嗅覚障害、レム睡眠障害、便秘、睡眠障害、記憶障害、うつ、不安、頭痛、腰痛の症状を含む）、突発性及び薬剤誘発性パーキンソニズム、脳炎

後パーキンソニズム、進行性核上麻痺、多系統萎縮症、大脳皮質基底核変性症、レビー小体型認知症、小脳性運動失調、パーキンソニズム－ALS認知症複合及び大脳基底核石灰化を含む）、パーキンソン病におけるレボドパ誘発性ジスキネジア、薬剤誘発性ジスキネジア、侵害受容性疼痛（外傷痛、片頭痛、頭痛、慢性疼痛（腰背部痛、リウマチ性関節痛、繊維筋痛症、骨関節炎など）、炎症性疼痛）、神経因性疼痛（帯状疱疹痛、三叉神経痛、複合性局所疼痛症候群、末梢神経障害（糖尿病性神経障害、ハンセン病など）、化学療法誘発性末梢神経障害、幻影痛、中枢性疼痛（脊椎損傷後痛、脳卒中後痛など）、ギランバレー症候群に伴う疼痛、多発性硬化症に伴う疼痛、パーキンソン病に伴う疼痛、神経因性疼痛に伴う痛覚過敏またはアロディニア）、疲労（パーキンソン疲労、多発性硬化症疲労、睡眠障害又は日周期リズムの障害により引き起こされる疲労、投薬誘発性パーキンソニズムを含む慢性疲労症候群など）、片頭痛、統合失調症、自閉症、ジル・ド・ラ・トゥーレット症候群、双極性障害、うつ病、不安（全般的な不安障害、パニック障害及び強迫性障害を含む）、睡眠障害（不眠症、過眠症、睡眠発作、レム睡眠障害を含む）、うつ病における睡眠障害、心不整脈、高血圧、癌、糖尿病、不妊症及び性機能不全を含む多様な疾患及び障害である、請求項11に記載の治療剤および／又は予防剤。

[請求項13]

T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患または精神疾患が、パーキンソン病（振戦、筋硬直・筋固縮、無動・寡動、姿勢反射障害、嗅覚障害、レム睡眠障害、便秘、睡眠障害、記憶障害、うつ、不安、頭痛、腰痛の症状を含む）、パーキンソン病におけるレボドパ誘発性ジスキネジア、本態性振戦、不安（全般的な不安障害）、または神経因性疼痛（帯状疱疹痛、三叉神経痛、複合性局所疼痛症候群、末梢神経障害（糖尿病性神経障害、ハンセン病など）、化学療法誘発性末梢神経障害、幻影痛、中枢性疼痛（脊椎損傷後痛、脳卒

中後痛など）、ギランバレー症候群に伴う疼痛、多発性硬化症に伴う疼痛、パーキンソン病に伴う疼痛、神経因性疼痛に伴う痛覚過敏またはアロディニア）である、請求項 11 に記載の治療剤及び／又は予防剤。

[請求項14] T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患または精神疾患が、パーキンソン病（振戦、筋硬直・筋固縮、無動・寡動、姿勢反射障害を含む）、本態性振戦、または化学療法誘発性末梢神経障害である、請求項 11 に記載の治療剤及び／又は予防剤。

[請求項15] 治療が必要な患者に、治療上の有効量の請求項 1～9 のいずれか一項に記載の化合物、又はその製薬学的に許容される塩を投与することを含む、T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患または精神疾患を治療及び／又は予防するための方法。

[請求項16] T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患または精神疾患の治療剤及び／又は予防剤を製造するための、請求項 1～9 のいずれか一項に記載の化合物、又はその製薬学的に許容される塩の使用。

[請求項17] T型カルシウムチャネルの異常によって惹起される神経系疾患または精神疾患の治療及び／又は予防に使用するための、請求項 1～9 のいずれか一項に記載の化合物、又はその製薬学的に許容される塩。

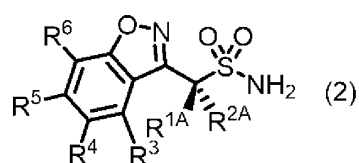
[請求項18] パーキンソン病治療薬、本態性振戦治療薬、または神経因性疼痛治療薬に分類される薬剤から選択される少なくとも 1 種以上の薬剤と併用することを特徴とする、T型カルシウムチャネルの異常が関与する疾患を治療するための、請求項 1～9 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩を含有する医薬。

[請求項19] 請求項 1～9 のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩を含有する医薬と、パーキンソン病治療薬、本態性振戦治療薬、または神経因性疼痛治療薬に分類される薬剤から選択される少なくとも 1 種以上の薬剤とを組み合わせる医薬。

[請求項20] パーキンソン病治療薬、本態性振戦治療薬、または神経因性疼痛治療薬に分類される薬剤から選択される少なくとも1種以上の薬剤と併用することを特徴とする、神経系疾患又は精神疾患を治療するための、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩を含有する医薬。

[請求項21] 式(2)：

[化2]



[式中、

R^{1A}は、水素、ハロゲン、C₁₋₆アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又はC₃₋₆シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、

R^{2A}は、ハロゲン、C₁₋₆アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又はC₃₋₆シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、ここにおいて、R^{1A}とR^{2A}は、異なる置換基であり、

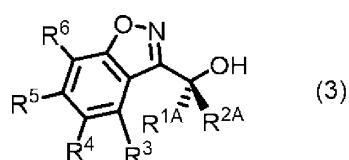
R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁₋₆アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、C₃₋₆シク

ロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又は C_{1-6} アルコキシ（該アルコキシはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表す。]

で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩の製造方法であって、下記の工程1～3を含む製造方法；

（工程1）式（3）：

[化3]



[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 は、上記と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩と式（4a）または（4b）：

[化4]

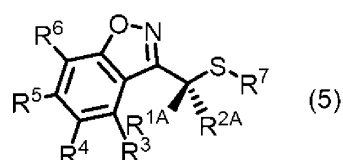


[式中、 R^7 は、2-（メトキシカルボニル）エチル、メシチレンカルボニロキシメチル、2-ベンゾチアゾイル（該基は、ベンゼン環上に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、 C_{1-6} アルコキシ（該アルコキシはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、水酸基、シアノ、ニトロ、アミノ（該アミノは、 C_{1-3} アルキルによって1～2個置換されていてもよい）

、カルボン酸、カルバモイル（該カルバモイルは、アミノ部分がC₁–₃アルキルによって1～2個置換されていてもよい）、C₁–₆アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、2-ピリジル、2-ピリミジニルまたは2-（トリメチルシリル）エチルから選択されるスルフィン酸塩を放出することが可能な脱離基を表す。]

で表される化合物またはその塩を反応させて、式（5）：

[化5]

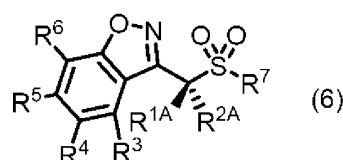


[式中、R^{1A}、R^{2A}、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、上記と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩を製造する工程、

（工程2）式（5）で表される化合物またはその塩を酸化して、式（6）：

[化6]



[式中、R^{1A}、R^{2A}、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、上記と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩を製造する工程、

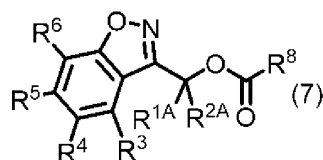
（工程3）式（6）で表される化合物またはその塩のR⁷を除去してスルホンアミド化して、式（2）で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩を製造する工程。

[請求項22]

以下の工程を含む、請求項21に記載の製造方法；

(工程 4 a) 式 (7) :

[化7]



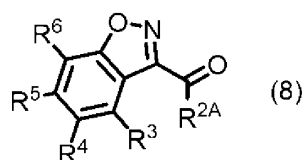
[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、請求項 21 と同じ基を表し、 R^8 は、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい）、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニロキシメトキシを表す。]

で表される化合物またはその塩を、リパーゼ、エステラーゼ、アミダーゼ、またはプロテアーゼから選択される加水分解酵素を用いて光学選択的に加水分解し、式 (3) で表される化合物を製造する工程。

[請求項 23] R^{1A} が水素であり、以下の工程を含む、請求項 21 に記載の製造方法；

(工程 4 b) 式 (8) :

[化8]



[式中、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、請求項 21 と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩を、還元酵素、および NADH または NADPH から選択される補酵素を用いて光学選択的に還元し、式 (3) で表される化合物を製造する工程。

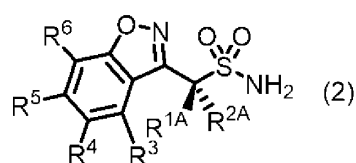
[請求項 24] R^7 が、2-ベンゾチアゾイルである、請求項 21～23 のいずれかに記載の製造方法。

[請求項25] R^8 が、メチルであり、加水分解酵素が、リパーゼである、請求項22または24に記載の製造方法。

[請求項26] R^{2A} が、メチルであり、還元酵素が、カルボニル還元酵素またはアルコール脱水素酵素である、請求項23または24に記載の製造方法。

[請求項27] 式(2)：

[化9]



[式中、

R^{1A} は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又は C_{3-6} シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、

R^{2A} は、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、又は C_{3-6} シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、ここにおいて、 R^{1A} と R^{2A} は、異なる置換基であり、

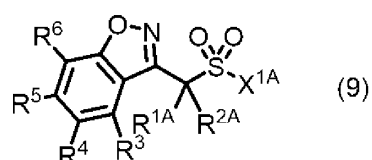
R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_{1-6} アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）、 C_{3-6} シク

ロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているもよい）、又は C_{1-6} アルコキシ（該アルコキシはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているもよい）を表す。]

で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩の製造方法であって、下記の工程1～2を含む製造方法；

（工程1）式（9）：

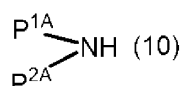
[化10]



[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 は、上記と同じ基を表し、 X^{1A} は、ハロゲンを表す。]

で表される化合物またはその塩と式（10）：

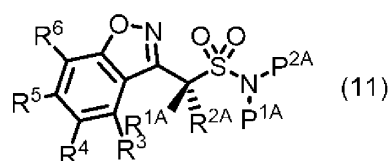
[化11]



[式中、 P^{1A} は、2-インダノール-1-イル、2-フェニルエタン-1-オール-2-イル、または3-メチルブタン-1-オール-2-イルを表し、 P^{2A} は、水素またはベンジル（該基は、ベンゼン環上に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で置換されているもよい）を表す。]

で表される光学活性化合物またはその塩を反応させてジアステレオマー分割をして、式（11）：

[化12]



[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 P^{1A} 、および P^{2A} は、上記と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩を製造する工程、

(工程2) 式(11)で表される化合物またはその塩を脱保護して、式(2)で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩を製造する工程。

[請求項28] R^{1A} が、水素であり、 R^{2A} が、メチルである、請求項27に記載の製造方法。

[請求項29] P^{1A} が、2-インダノール-1-イルであり、 P^{2A} が、水素である、請求項27または28に記載の製造方法。

[請求項30] X線粉末回折において、 $5.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $17.3^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折角($2\theta^\circ$)ピークを有する、形態Iの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド。

[請求項31] X線粉末回折において、 $5.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $14.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $17.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $19.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $19.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $21.6^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $22.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $23.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $23.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $26.5^\circ \pm 0.2^\circ$ から選択される4つ以上の回折角($2\theta^\circ$)ピークを有する、形態Iの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド。

[請求項32] X線粉末回折において、 $8.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $17.6^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折角($2\theta^\circ$)ピークを有する、形態IIの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-

1-スルホンアミド。

[請求項33] X線粉末回折において、 $8.7^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $13.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $15.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $17.6^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $20.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $21.6^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $22.6^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $26.2^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $26.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、および $35.2^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ から選択される4つ以上の回折角($2\theta^{\circ}$)ピークを有する、形態IIの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド。

[請求項34] X線粉末回折において、 $11.1^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、および $20.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ に回折角($2\theta^{\circ}$)ピークを有する、形態IIIの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド。

[請求項35] X線粉末回折において、 $11.1^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $13.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $17.0^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $20.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $21.4^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $22.1^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $22.4^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $24.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $26.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、および $27.9^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ から選択される4つ以上の回折角($2\theta^{\circ}$)ピークを有する、形態IIIIの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド。