

【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25年8月22日 (2013.8.22)

【公表番号】特表2010-513334(P2010-513334A)

【公表日】平成22年4月30日 (2010.4.30)

【年通号数】公開・登録公報2010-017

【出願番号】特願2009-541766(P2009-541766)

【国際特許分類】

C 07 C 235/18 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 17/16 (2006.01)

A 61 P 17/14 (2006.01)

A 61 P 17/04 (2006.01)

A 61 P 17/08 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 D 213/61 (2006.01)

A 61 K 31/44 (2006.01)

C 07 D 413/12 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

C 07 D 417/12 (2006.01)

C 07 D 409/12 (2006.01)

A 61 K 31/4535 (2006.01)

C 07 D 401/12 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

C 07 D 405/12 (2006.01)

A 61 K 31/443 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 31/4545 (2006.01)

A 61 K 31/4436 (2006.01)

C 07 D 241/12 (2006.01)

A 61 K 31/4965 (2006.01)

A 61 K 31/165 (2006.01)

C 07 D 239/26 (2006.01)

A 61 K 31/505 (2006.01)

C 07 D 237/08 (2006.01)

A 61 K 31/50 (2006.01)

C 07 D 213/74 (2006.01)

C 07 D 213/73 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 C 235/18 C S P

A 61 P 17/00

A 61 P 17/06

A 61 P 35/00

A 61 P 17/16

A 61 P 17/14

A 61 P 17/04

A 6 1 P 17/08  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
C 0 7 D 213/61  
A 6 1 K 31/44  
C 0 7 D 413/12  
A 6 1 K 31/454  
C 0 7 D 417/12  
C 0 7 D 409/12  
A 6 1 K 31/4535  
C 0 7 D 401/12  
A 6 1 K 31/4709  
C 0 7 D 405/12  
A 6 1 K 31/443  
A 6 1 K 31/444  
A 6 1 K 31/4545  
A 6 1 K 31/4436  
C 0 7 D 241/12  
A 6 1 K 31/4965  
A 6 1 K 31/165  
C 0 7 D 239/26  
A 6 1 K 31/505  
C 0 7 D 237/08  
A 6 1 K 31/50  
C 0 7 D 213/74  
C 0 7 D 213/73  
A 6 1 K 45/00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成25年7月5日(2013.7.5)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

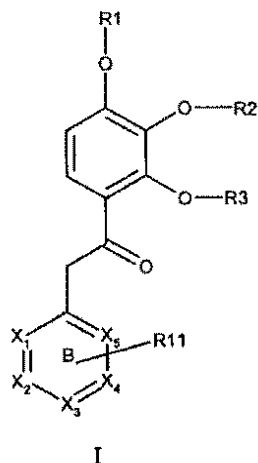
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式Iで示される化合物、または医薬的に許容され生理的に分解可能なそのエステル、医薬的に許容されるその塩、水和物、N-オキシドもしくは溶媒和物：

## 【化 1】



[ 式中、

$X_1$ 、 $X_2$ 、 $X_3$ 、 $X_4$ および $X_5$ は、互いに独立に、-CH-またはNを表すか；または  
 $X_3$ 、 $X_4$ および $X_5$ は互いに独立に-CH-またはNを表し、 $X_1$ および $X_2$ は互いに独立にCを表し、  
 更なる6員芳香環の一部を構成し；

$R_1$ は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアルキルカルボニルを表し、それらは全て、 $R_4$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または $R_1$ は水素を表し；

$R_2$ は、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、ヘテロシクロアルケニル、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルアルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを表し、それらは全て、 $R_5$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_2$ は、水素または $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_{12}$ を表し；

$R_3$ は、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、ヘテロシクロアルケニル、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルアルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを表し、それらは全て、 $R_6$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_3$ は、水素、 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-\text{ヘテロシクロアルキル}$ または $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_{12}$ を表し；

$R_4$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、オキソ、アルコキシ、ヒドロキシまたはハロアルキルを表し；

$R_5$ は、アルキルアリール、カルボキシ、アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、カルバモイル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、複素環、アミノカルボニル、アルキルチオ、アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキシ、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルカルボニルオキシまたはアミノを表し、それらは全て、 $R_7$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_5$ は、水素、オキソ、ハロゲン、シアノまたはニトロを表し；

$R_6$ は、アルキルアリール、カルボキシ、アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、カルバモイル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、複素環、アミノカルボニル、アルキルチオ、アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニル、ヒドロキシ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシまたはアミノを表し、それらは全て、 $R_8$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_6$ は、水素、オキソ、ハロゲン、シアノまたはニトロを表し；

$R_7$ は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルキニル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルチオ、ヘテロシクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アルキルカルボニル、ヘテロアリール、アリールオキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシアルキル、アミノ、ヒドロキシまたはカルボキシを表し、それらは全て、 $R_{10}$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_7$ は、水素、ハロゲンまたはオキソを表し；

$R_8$ は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルキニル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、ヘテロシクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アルキルカルボニル、ヘテロアリール、アリールオキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシアルキル、アミノ、ヒドロキシまたはカルボキシを表し、それらは全て、 $R_{10}$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_8$ は、水素、ハロゲンまたはオキソを表し；

$R_9$ は、水素、アルキル、ハロアルキルまたはヒドロキシアルキルを表し；

$R_{10}$ は、水素、アルキル、オキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、アミノ、アルコキシ、ハロアルキルまたはヒドロキシアルキルを表し；

$R_{11}$ は、水素、ハロゲン、シアノ、アミノ、アルキル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アミノ、シアノまたはアルコキシから選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基を表し；

$R_{12}$ は、アルキルアリール、アリールアルキル、カルボキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、カルバモイル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、複素環、アミノカルボニル、アルキルチオ、アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキシ、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルカルボニルオキシまたはアミノを表し、それらは全て、 $R_8$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_{12}$ は水素を表し；

但し、

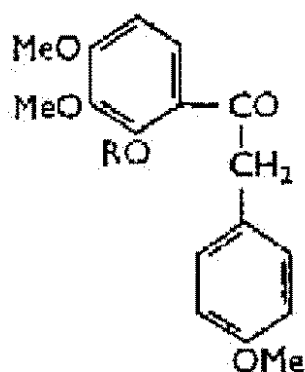
$R_1$ 、 $R_2$ および $R_3$ が同時にメチルであることはできないものとし；

$R_2$ および $R_3$ の両方が水素であるとき、 $R_1$ はメチルまたは水素であることはできないものとし；

$R_1$ がメチルまたは水素であり、 $R_2$ がメチルであり、 $R_3$ が水素であるとき、環Bはフェニルであることはできないものとする]

但し、式Iで示される化合物は、式：

【化2】



[ 式中、Rはベンジルであり、Meはメチルである ]  
で示される化合物ではない。

## 【請求項 2】

環Bが、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、メトキシ、 $-NH_2$ または $C_{1-4}$ アミノから選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよいピリジル、ピラジニル、キノリル、ピリミジニルまたはピリダジニルを表す請求項 1 に記載の化合物。

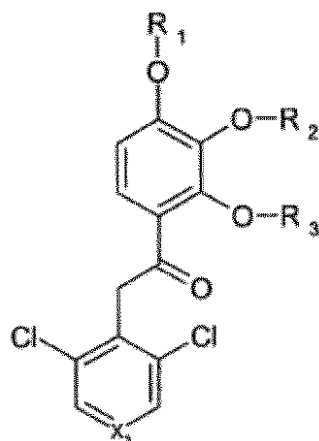
## 【請求項 3】

$R_{11}$ で置換されてもよい環Bが、2-(6-クロロ-ピラジニル)、2-ピラジニル、4-(3-ブロモ-ピリジル)、4-(3,5-ジブロモ-ピリジル)、4-(6-クロロ-ピリミジニル)、2-(4-クロロ-ピリジル)、3-(2-クロロ-ピリジル)、4-(2-メトキシ-ピリジル)、4-(2-シアノ-ピリジル)、3-ピリダジニル、4-(2-*t*-ブチルアミノ-3,5-ジクロロ-ピリジル)、4-(2-アミノ-3,5-ジクロロ-ピリジル)、4-(3,5-ジクロロ-ピリジル)、2-(3-ブロモ-ピラジニル)、4-ピリジル、4-キノリルまたは4-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジル)を表す請求項 1 または 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

式 I が式 Iz :

## 【化 3】



Iz

[ 式中、 $X_3$  は、 $-CH-$ またはNを表す ]  
を表す請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R_1$  がメチルまたはエチルを表す請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R_2$  が、 $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルケニル、 $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル、ヒドロキシ $C_1-C_6$ アルキル、ハロ $C_1-C_6$ アルキル、 $C_1-C_6$ アルキニル、 $C_1-C_6$ シクロアルキル、 $C_1-C_6$ アルキル $C_6-C_{10}$ アリール、 $C_1-C_6$ アルキル $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル、または $C_1-C_6$ アルキルカルボニルオキシを表し、それらは全て、 $R_5$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよい請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 7】

$R_2$  が、メチル、エチル、プロピル、*t*-ブトキシカルボニルメチル、アリル、ジフルオロメチル、エチルベンゼン、メチルベンゼン、ブテニル、ヒドロキシエチル、トリル、ペンテニル、メトキシエチル、ブチニル、プロピニル、シクロペンチルを表し、これらは全て、 $R_5$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよい請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R_3$  が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシエチル、ブテニル、ペンテニル、アリル、ブチニル、ベンジル、メチルベンゼン、エチルベンゼン

、エチルピリジン、トリル、トルオイル、プロピルベンゼン、メチルナフチル、エチルナフチル、メトキシエチル、メトキシプロピルを表し、これらは全て、 $R_6$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく、置換基 $R_6$ は、 $R_8$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_3$ が、水素、 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-$ ヘテロシクロアルキルまたは $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_{12}$ を表す請求項1～7のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】

$R_5$ が、メチル、*t*-ブトキシ、エテニル、シクロプロピル、プロペニル、フェニル、ブテニル、プロピニル、メチルヒドロキシ、エチニル、アリル、エチルまたはメトキシを表し、これらは全て、 $R_7$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_5$ が、水素、オキソ、クロロ、フルオロまたはヒドロキシを表す請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項10】

$R_6$ が、エテニル、メチル、*t*-ブトキシ、イソキサゾリル、メトキシ、プロピニル、ブテニル、フェニル、ピリジル、ベンゾオキサゾリル、チアゾリル、[1,3,4]チアジアゾリル、[1,2,4]オキサジアゾリル、2,3-ジヒドロ-1*H*-イソインドリル、エトキシ、チオフェニル、プロピル、エチル、ブチル、ペンチル、アリル、イソプロポキシ、イソプロピル、ナフチル、シクロヘキシル、ヒドロキシ、シクロペンチル、フェノキシ、トリル、トルオイル、ベンゾイル、カルボニルナフタレン、エチルベンゼン、キノリニル、 $-\text{NH}_2$ 、エトキシカルボニル、メトキシカルボニル、カルバモイル、イソインドール、メチルアミン、ピロリジル、モルホリニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、ブチルアミン、プロピルアミン、エチルアミン、シクロヘブチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、インダニルまたはエトキシエチルを表し、これらは全て、 $R_8$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_6$ が、水素、オキソ、フルオロ、クロロまたはシアノを表す請求項1～9のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

$R_8$ が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、フェニル、シクロプロピル、エトキシ、メトキシ、アリル、エテニル、エトキシカルボニル、ヒドロキシ、ナフチル、シクロヘキシル、メトキシカルボニル、フェノキシ、イソプロポキシ、 $-\text{NH}_2$ 、メチルアミン、ピロリジニル、モルホリニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、シクロヘブチル、シクロペンチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ジメチルアミノ、フラニル、ピリジル、トリル、ピペリジニル、アセチル、チオフェニル、シクロヘブチルを表し、これらは全て、 $R_{10}$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_8$ が、水素、オキソ、クロロ、プロモ、フルオロ、シアノまたはトリフルオロメチルを表す請求項1～10のいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

$R_9$ が、水素、メチルまたはエチルを表す請求項1～11のいずれかに記載の化合物。

【請求項13】

$R_{10}$ が、水素、オキソ、メチル、ヒドロキシ、フルオロ、シアノ、クロロまたはメトキシを表す請求項1～12のいずれかに記載の化合物。

【請求項14】

$R_3$ が、 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NH}-\text{R}_{12}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-$ ヘテロシクロアルキル、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ フェニル- $R_6$ 、または $-\text{CH}_2-$ フェニル- $R_6$ を表す請求項1～13のいずれかに記載の化合物。

【請求項15】

$R_2$ および/または $R_3$ が下記の基を表す請求項1～14のいずれかに記載の化合物： $-\text{CH}_2\text{COOH}$ 、メチル、水素、アリル、エチル、*t*-ブトキシカルボニルメチル、ジフルオロメチル、3-メチル-5-メチルイソキサゾール、2-メトキシ-エタン、2-ブチン、2-メチル-2-ブテン、2-フェニルエタン、ベンジル、2-メチル-1,3-ベンゾオキサゾール、4-メチル-2-メチルチアゾール、2-メチル-5-シクロプロピル-[1,3,4]チアジアゾール、3-メチル-[1,2,4]オキサジアゾール、エチルアセテート、(4-クロロフェニル)エタン、5-クロロ-2-メチル-

チオフェン、フェノキシエタン、(4-メチルフェニル)エタン、3-フェニルプロパン、(3-メトキシフェニル)エタン、(4-メトキシフェニル)エタン、(3-プロモフェニル)エタン、(2-メトキシフェニル)エタン、(4-フルオロフェニル)エタン、(2-フルオロフェニル)エタン、(3,4-ジメトキシフェニル)エタン、ベンジルアセテート、イソプロピルアセテート、3-メチル安息香酸メチルエステル、3-メチル-ブタン、1-ヘキシル、ブタ-1-エン、ペンタ-1-エン、1-プロピル、1-ブチル、2-メチル-プロパン、酪酸エチルエステル、4-メチル-ベンジル、3-クロロ-ベンジル、プロボキシベンゼン、1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン、4-メチル-ベンゾニトリル、2-メチル-ナフタレン、1-ペンチル、メチル-シクロヘキサン、3-メチル-ベンゾニトリル、1-エトキシ-4-クロロ-ベンゼン、2-エチル-ブタン、2-ヒドロキシ-エタン、4-メチル安息香酸メチルエステル、1-ナフタレン-2-イル-エタノン、2,5-ジメトキシ-フェニル-エタノン、1-p-トリル-エタノン、4-フルオロ-ベンジル、2-フルオロ-ベンジル、5-トリフルオロメチル-ベンジル、5-トリフルオロメトキシ-ベンジル、3-フルオロ-5-トリフルオロメチル-ベンジル、1-(2-メトキシ-フェニル)-エタノン、1-(2,4-ジメチル-フェニル)-エタノン、4-クロロ-ベンジル、2-ジフルオロメトキシ-ベンジル、4-イソプロピル-ベンジル、2-フルオロ-6-トリフルオロメチル-ベンジル、2,3-ジフルオロ-4-メチル-ベンジル、2-メチル-ベンジル、3-メチル-ベンジル、ペンタ-2-エン、6-メチル-2-メチル-キノリン、2-クロロ-ベンジル、3-メトキシ-ベンジル、4-メトキシ-ベンジル、(3-クロロ-フェニル)-エタン、5-メチル-ヘキサン、エチル-シクロヘキサン、ペンタン酸エチルエステル、(プロボキシメチル)-ベンゼン、アセトアミド、2-エチル-イソインドール-1,3-ジオン、2-プロピル-イソインドール-1,3-ジオン、N-メチル-アセトアミド、メチル-シクロプロパン、ブタ-1-エン、4-イル-ブタ-1-エン、2-メチル-ペンタ-2-エン、エタノール、2-メトキシ-エタン、ブタ-2-イン、プロピン、アセテート、1-ピロリジン-1-イル-エタノン、N-ベンジルアセトアミド、1-モルホリン-4-イル-エタノン、N-フェニル-アセトアミド、N-メチル-N-フェニル-アセトアミド、N-(3-ヒドロキシ-3-メチル-ブチル)-アセトアミド、N-n-プロピル-アセトアミド、N-エチル-アセトアミド、N-イソプロピル-アセトアミド、N-ブチル-アセトアミド、N-シクロペンチル-アセトアミド、N-(3-メチル-ブチル)-アセトアミド、N-(4-メトキシ-ベンジル)-アセトアミド、N-(2,2-ジメチル-プロピル)-アセトアミド、N-シクロヘキシル-アセトアミド、N-(3-メトキシ-ベンジル)-アセトアミド、N-シクロヘブチル-アセトアミド、N-(2-メトキシ-ベンジル)-アセトアミド、N-シクロヘキシルメチル-アセトアミド、N-(2-ヒドロキシ-エチル)-アセトアミド、N-(1-フェニル-エチル)-アセトアミド、N-(3-ヒドロキシ-プロピル)-アセトアミド、N-(2-メトキシ-エチル)-アセトアミド、N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-アセトアミド、N-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-アセトアミド、N-(1-フェニル-エチル)-アセトアミド、N-(3-イソプロボキシ-プロピル)-アセトアミド、N-フラン-2-イルメチル-アセトアミド、N-ピリジン-2-イルメチル-アセトアミド、N-ピリジン-3-イルメチル-アセトアミド、N-(2-フェノキシ-エチル)-アセトアミド、N-ピリジン-4-イルメチル-アセトアミド、N-(4-エチル-ベンジル)-アセトアミド、N-(3,5-ジフルオロ-ベンジル)-アセトアミド、N-(2,3-ジフルオロ-ベンジル)-アセトアミド、N-(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アセトアミド、N-(2-メチル-ベンジル)-アセトアミド、N-(3-フルオロ-ベンジル)-アセトアミド、N-(3-メチル-ベンジル)-アセトアミド、N-(4-メチル-ベンジル)-アセトアミド、N-フェネチル-アセトアミド、N-(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アセトアミド、N-(3-フェニル-プロピル)-アセトアミド、N-(2-クロロ-ベンジル)-アセトアミド、N-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-アセトアミド、N-(3-クロロ-ベンジル)-アセトアミド、N-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アセトアミド、N-(4-クロロ-ベンジル)-アセトアミド、N-(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アセトアミド、N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)-アセトアミド、N-(2-アセチルアミノ-エチル)-アセトアミド、(R)-N-(2-ヒドロキシ-2-フェニル-エチル)-アセトアミド、(S)-N-(2-ヒドロキシ-2-フェニル-エチル)-アセトアミド、N-チオフェン-2-イルメチル-アセトアミド、N-[3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピル]-アセトアミド、N-(2-ヒドロキシ-インダン-1-イル)-アセトアミド、N-シクロヘブチルメチル-アセトアミド、N-[2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-エチル]-アセトアミド、N-(4-ジメチルアミノ-ブチル)-アセトア

ミド、シクロペンタン、シクロプロピルメチル、フェニル-エタン、酢酸ベンジルエステル、2-メチル-ベンゾニトリル、2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)エタン、(4-ピリジル)エタン、(3-ピリジル)エタン、(2-ピリジル)エタン、(4-ベンゾニトリル)エタン、(4-メチルスルフィニル-フェニル)エタン、(4-メチルスルホニル-フェニル)エタン、1-フェニル-プロパン、2-フェニル-プロパンまたは1-メチル-2-フェニル-エタン。

【請求項 16】

R<sub>2</sub>がメチルを表す請求項 1 ~ 15 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 17】

R<sub>12</sub>が、アルキル、シクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アリール、アリールアルキル、アルキルカルボニルアミノを表し、それらは全て、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリールオキシ、アミノ、ヒドロキシ、ハロゲン、オキシから選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく、該置換基は全て、オキシまたはヒドロキシルによって置換されてもよく；または、R<sub>12</sub>が水素を表す請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

800ダルトン未満の分子量を有する請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 19】

下記化合物、および医薬的に許容され生理的に分解可能なそのエステル、医薬的に許容されるその塩、水和物、N-オキシドまたは溶媒和物から選択される請求項 1 に記載の化合物：

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2-ヒドロキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-エタノン (化合物101)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3-ヒドロキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-エタノン (化合物102)

1-(2-アリルオキシ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物103)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2,3-ジエトキシ-4-メトキシ-フェニル)-エタノン (化合物104)

{2-t-ブトキシカルボニルメトキシ-6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-3-メトキシ-フェノキシ}-酢酸t-ブチルエステル (化合物105)

1-(2,3-ビス-アリルオキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物106)

1-(2,3-ビス-ジフルオロメトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物107)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(5-メチル-イソキサゾル-3-イルメトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物108)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物109)

1-(2-ブタ-2-エニルオキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物110)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-メチル-ブタ-2-エニルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物111)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3,4-ジメトキシ-2-フェネチルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物112)

1-(2-ベンジルオキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物113)

1-(2-アリルオキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物114)

1-[2-(ベンゾオキサゾル-2-イルメトキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物115)



2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-メチル-チアゾル-4-イルメトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物116)

1-[2-(5-シクロプロピル-[1,3,4]チアジアゾル-2-イルメトキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物117)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-([1,2,4]オキサジアゾル-3-イルメトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物118)

{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}酢酸エチルエステル (化合物119)

1-{2-[2-(4-クロロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物120)

1-[2-(5-クロロ-チオフェン-2-イルメトキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物121)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-フェノキシ-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物122)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-p-トリル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物123)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-フェニル-プロポキシ)-フェニル]-エタノン (化合物124)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{3,4-ジメトキシ-2-[2-(3-メトキシ-フェニル)-エトキシ]-フェニル}-エタノン (化合物125)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{3,4-ジメトキシ-2-[2-(4-メトキシ-フェニル)-エトキシ]-フェニル}-エタノン (化合物126)

1-{2-[2-(3-プロモ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物127)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{3,4-ジメトキシ-2-[2-(2-メトキシ-フェニル)-エトキシ]-フェニル}-エタノン (化合物128)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(4-フルオロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物129)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(2-フルオロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物130)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物131)

{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-酢酸ベンジルエステル (化合物132)

{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-酢酸イソプロピルエステル (化合物133)

3-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシメチル}-安息香酸メチルエステル (化合物134)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-メチル-ブトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物135)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2-ヘキシルオキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-エタノン (化合物136)

1-(2-ブタ-3-エニルオキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物137)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3,4-ジメトキシ-2-ペンタ-4-エニルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物138)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3,4-ジメトキシ-2-プロポキシ-フェニル)-エタノン (化合物139)

1-(2-ブトキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物140)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2-イソブトキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-エタノン (化合物141)

4-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-酪酸エチルエステル (化合物142)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(4-メチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物143)

1-[2-(3-クロロ-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物144)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-フェノキシ-プロポキシ)-フェニル]-エタノン (化合物145)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{3,4-ジメトキシ-2-[2-(4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エトキシ]-フェニル}-エタノン (化合物146)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシメチル}-ベンゾニトリル (化合物147)

4-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシメチル}-ベンゾニトリル (化合物148)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(ナフタレン-2-イルメトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物149)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3,4-ジメトキシ-2-ベンチルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物150)

1-(2-シクロヘキシルメトキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物151)

3-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシメチル}-ベンゾニトリル (化合物152)

1-{2-[2-(4-クロロ-フェノキシ)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物153)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(2-エチル-ブトキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物154)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物155)

4-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシメチル}-安息香酸メチルエステル (化合物156)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-ナフタレン-2-イル-2-オキソ-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物157)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(2,5-ジメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物158)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-オキソ-2-p-トリル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物159)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(4-フルオロ-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物160)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(2-フルオロ-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物161)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物162)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物163)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(3-フルオロ-5-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物164)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{3,4-ジメトキシ-2-[2-(2-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エトキシ]-フェニル}-エタノン (化合物165)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(2,4-ジメチル-フェニル)-2-オキソ-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物166)

1-[2-(4-クロロ-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物167)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(2-ジフルオロメトキシ-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物168)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(4-イソプロピル-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物169)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(2-フルオロ-6-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物170)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2-(2,3-ジフルオロ-4-メチル-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物171)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-メチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物172)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-メチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物173)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3,4-ジメトキシ-2-ペンタ-2-エニルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物174)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-メチル-キノリン-6-イルメトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物175)

1-[2-(2-クロロ-ベンジルオキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物176)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(3-メトキシ-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物177)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(4-メトキシ-ベンジルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物178)

1-{2-[2-(3-クロロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物179)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(5-メチル-ヘキシルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物180)

1-[2-(2-シクロヘキシル-エトキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物181)

5-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-ペンタン酸エチルエステル (化合物182)

1-[2-(3-ベンジルオキシ-プロポキシ)-3,4-ジメトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物183)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物184)

2-(2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-エチル)-イソインドール-1,3-ジオン (化合物185)

2-(3-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-プロピル)-イソインドール-1,3-ジオン (化合物186)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-メチル-アセトアミド (化合物187)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3-エトキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-エタノン (化合物188)

1-(3-シクロプロピルメトキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物189)

1-(2-アリルオキシ-3-ブタ-3-エニルオキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物190)

- 1-(3-ブタ-3-エニルオキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物191)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2,4-ジメトキシ-3-プロボキシ-フェニル)-エタノン (化合物192)
- 1-(3-アリルオキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物193)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2,4-ジメトキシ-3-(4-メチル-ペンタ-3-エニルオキシ)-フェニル]-エタノン (化合物194)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-2,4-ジメトキシ-フェニル]-エタノン (化合物195)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2,4-ジメトキシ-3-フェネチルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物196)
- 1-(3-ベンジルオキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物197)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2,4-ジメトキシ-3-ペンタ-2-エニルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物198)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[2,4-ジメトキシ-3-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物199)
- 1-(3-ブタ-2-エニルオキシ-2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物200)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(2,4-ジメトキシ-3-プロパ-2-エニルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物201)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物202)
- N-ベンジル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物203)
- 2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物204)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-フェニル-アセトアミド (化合物205)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-メチル-N-フェニル-アセトアミド (化合物206)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-ヒドロキシ-3-メチル-ブチル)-アセトアミド (化合物207)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物208)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-イソプロピル-アセトアミド (化合物209)
- N-ブチル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物210)
- N-シクロペンチル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物211)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-メチル-ブチル)-アセトアミド (化合物212)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(4-メトキシ-ベンジル)-アセトアミド (化合物213)
- 2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2,2-ジメチル-プロピル)-アセトアミド (化合物214)
- N-シクロヘキシル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物215)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-メトキシ-ベンジル)-アセトアミド (化合物216)

N-シクロヘブチル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物217)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-メトキシ-ベンジル)-アセトアミド (化合物218)

N-シクロヘキシルメチル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物219)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ヒドロキシ-エチル)-アセトアミド (化合物220)

(R)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(1-フェニル-エチル)-アセトアミド (化合物221)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-ヒドロキシ-プロピル)-アセトアミド (化合物222)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-メトキシ-エチル)-アセトアミド (化合物223)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-アセトアミド (化合物224)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-アセトアミド (化合物225)

(S)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(1-フェニル-エチル)-アセトアミド (化合物226)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-イソプロポキシ-プロピル)-アセトアミド (化合物227)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-フラン-2-イルメチル-アセトアミド (化合物228)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-ピリジン-2-イルメチル-アセトアミド (化合物229)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-ピリジン-3-イルメチル-アセトアミド (化合物230)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-フェノキシ-エチル)-アセトアミド (化合物231)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-ピリジン-4-イルメチル-アセトアミド (化合物232)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(4-エチル-ベンジル)-アセトアミド (化合物233)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3,5-ジフルオロ-ベンジル)-アセトアミド (化合物234)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2,3-ジフルオロ-ベンジル)-アセトアミド (化合物235)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アセトアミド (化合物236)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-メチル-ベンジル)-アセトアミド (化合物237)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-フルオロ-ベンジル)-アセトアミド (化合物238)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-メチル-ベンジル)-アセトアミド (化合物239)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(4-メチル-ベンジル)-アセトアミド (化合物240)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-フェネチル-アセトアミド (化合物241)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アセトアミド (化合物242)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(3-フェニル-プロピル)-アセトアミド (化合物243)

N-(2-クロロ-ベンジル)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物244)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-アセトアミド (化合物245)

N-(3-クロロ-ベンジル)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物246)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アセトアミド (化合物247)

N-(4-クロロ-ベンジル)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物248)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アセトアミド (化合物249)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)-アセトアミド (化合物250)

N-(2-アセチルアミノ-エチル)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物251)

(R)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ヒドロキシ-2-フェニル-エチル)-アセトアミド (化合物252)

(S)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ヒドロキシ-2-フェニル-エチル)-アセトアミド (化合物253)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-チオフエン-2-イルメチル-アセトアミド (化合物254)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-[3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピル]-アセトアミド (化合物255)

(2R)-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(2-ヒドロキシ-インダン-1-イル)-アセトアミド (化合物256)

N-シクロヘプチルメチル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物257)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-[2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-エチル]-アセトアミド (化合物258)

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-(4-ジメチルアミノ-ブチル)-アセトアミド (化合物259)

1-(3-シクロペンチルオキシ-2-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物260)

1-(3-シクロプロピルメトキシ-2-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物261)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3-エトキシ-2-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-エタノン (化合物262)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(3-エトキシ-4-メトキシ-2-フェネチルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物263)

1-[2-(5-シクロプロピル-[1,3,4]チアジアゾル-2-イルメトキシ)-3-エトキシ-4-メトキシ-フェニル]-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物264)

{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2-エトキシ-3-メトキシ-フェノキシ}-酢酸ベンジルエステル (化合物265)

1-(3-アリルオキシ-2-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物266)

2-{2-アリルオキシ-6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-3-メトキシ-フェノキシメチル}-ベンゾニトリル (化合物267)

1-(3-アリルオキシ-4-メトキシ-2-フェネチルオキシ-フェニル)-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物268)

1-{3-アリルオキシ-2-[2-(4-フルオロ-フェニル)-エトキシ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-エタノン (化合物269)

N-ベンジル-2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-アセトアミド (化合物270)

2-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジン-4-イル)-1-(3,4-ジメトキシ-2-フェネチルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物271)

2-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(4-フルオロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物272)

2-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジン-4-イル)-1-{3,4-ジメトキシ-2-[2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)-エトキシ]-フェニル}-エタノン (化合物274)

2-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジン-4-イル)-1-(2-ヒドロキシ-3,4-ジメトキシ-フェニル)-エタノン (化合物275)

4-(2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-1-オキシ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-エチル)-ベンゾニトリル (化合物276)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-ピリジン-4-イル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物277)

4-(2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-エチル)-ベンゾニトリル (化合物278)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-ピリジン-2-イル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物279)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-ピリジン-3-イル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物280)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(4-メタンスルフィニル-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物281)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(4-メタンスルホニル-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物282)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(1-フェニル-プロポキシ)-フェニル]-エタノン (化合物283)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(2-フェニル-プロポキシ)-フェニル]-エタノン (化合物284)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-[3,4-ジメトキシ-2-(1-メチル-2-フェニル-エトキシ)-フェニル]-エタノン (化合物285)

2-{6-[2-(6-クロロ-ピラジン-2-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物286)

2-{6-[2-(3-プロモ-ピラジン-2-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物287)

2-{6-[2-(2,6-ジクロロ-フェニル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物288)

2-[2,3-ジメトキシ-6-(2-ピリジン-4-イル-アセチル)-フェノキシ]-N-プロピル-アセトアミド (化合物289)

2-[2,3-ジメトキシ-6-(2-キノリン-4-イル-アセチル)-フェノキシ]-N-プロピル-アセトアミド (化合物290)

2-[2,3-ジメトキシ-6-(2-ピラジン-2-イル-アセチル)-フェノキシ]-N-プロピル-アセトアミド (化合物291)

2-{6-[2-(3-プロモ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物292)

2-{6-[2-(3,5-ジプロモ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物293)

2-{6-[2-(6-クロロ-ピリミジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物294)

2-{6-[2-(4-クロロ-ピリジン-2-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物295)

2-{6-[2-(2-クロロ-ピリジン-3-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物296)

2-{2,3-ジメトキシ-6-[2-(2-メトキシ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物297)

2-{6-[2-(2-シアノ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-プロピル-アセトアミド (化合物298)

2-[2,3-ジメトキシ-6-(2-ピリダジン-3-イル-アセチル)-フェノキシ]-N-プロピル-アセトアミド (化合物299)

2-(2-t-ブチルアミノ-3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(4-フルオロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物300)

2-(2-アミノ-3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-{2-[2-(4-フルオロ-フェニル)-エトキシ]-3,4-ジメトキシ-フェニル}-エタノン (化合物301)

2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-1-(4-エトキシ-3-メトキシ-2-フェネチルオキシ-フェニル)-エタノン (化合物302)

{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-酢酸 (化合物504) または

2-{6-[2-(3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル)-アセチル]-2,3-ジメトキシ-フェノキシ}-N-エチル-アセトアミド (化合物305)。

【請求項 20】

医療に使用する請求項 1 ~ 19 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 21】

皮膚疾患の処置に使用する請求項 1 ~ 19 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 19 のいずれかに記載の化合物を、医薬的に許容されるビヒクルもしくは賦形剤または医薬的に許容される担体と共に含有する医薬組成物。

【請求項 23】

さらなる処置活性化合物を1つまたはそれ以上含有する請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

任意に、他の処置活性化合物と組み合わせて投与される、皮膚疾患もしくは症状または急性もしくは慢性皮膚創傷疾患を予防、治療または改善するための請求項 22 または 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

皮膚疾患または症状が、増殖性および炎症性の皮膚疾患、乾癬、癌、表皮炎症、脱毛症、皮膚萎縮、ステロイド誘発性皮膚萎縮、皮膚老化、皮膚の光老化、ざ瘡、皮膚炎、アトピー性皮膚炎、脂漏性皮膚炎、接触皮膚炎、蕁麻疹、そう痒および湿疹から成る群から選択される請求項 24 に記載の医薬組成物。

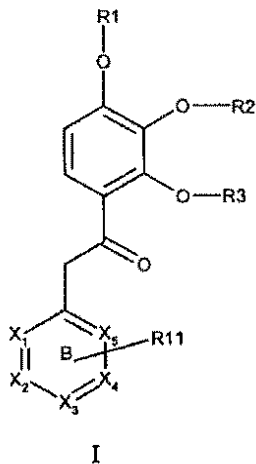
【請求項 26】

皮膚疾患もしくは症状または急性もしくは慢性皮膚創傷疾患を予防、治療または改善するための医薬組成物であって、下記式Iで示される化合物、または医薬的に許容され生理的に分解可能なそのエステル、医薬的に許容されるその塩、水和物、N-オキシドもしくは溶媒和物を、医薬的に許容されるビヒクルもしくは賦形剤または医薬的に許容される担体



と共に含有する医薬組成物：

【化 4】



[ 式中、

$X_1$ 、 $X_2$ 、 $X_3$ 、 $X_4$ および $X_5$ は、互いに独立に、-CH-またはNを表すか；または

$X_3$ 、 $X_4$ および $X_5$ は互いに独立に-CH-またはNを表し、 $X_1$ および $X_2$ は互いに独立にCを表し、更なる6員芳香環の一部を構成し；

$R_1$ は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアルキルカルボニルを表し、それらは全て、 $R_4$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または $R_1$ は水素を表し；

$R_2$ は、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、ヘテロシクロアルケニル、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルアルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを表し、それらは全て、 $R_5$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_2$ は、水素または $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_{12}$ を表し；

$R_3$ は、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、ヘテロシクロアルケニル、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルアルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを表し、それらは全て、 $R_6$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_3$ は、水素、 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-\text{ヘテロシクロアルキル}$ または $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_{12}$ を表し；

$R_4$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、オキソ、アルコキシ、ヒドロキシまたはハロアルキルを表し；

$R_5$ は、アルキルアリール、カルボキシ、アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、カルバモイル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、複素環、アミノカルボニル、アルキルチオ、アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキシ、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルカルボニルオキシまたはアミノを表し、それらは全て、 $R_7$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_5$ は、水素、オキソ、ハロゲン、シアノまたはニトロを表し；

$R_6$ は、アルキルアリール、カルボキシ、アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、カルバモイル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、複素環、アミノカルボニル、アルキルチオ、アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニル、ヒドロキシ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシまたはアミノを表し、それらは全て、 $R_8$ から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、 $R_6$ は、水素

、オキソ、ハロゲン、シアノまたはニトロを表し；

R<sub>7</sub>は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルキニル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルチオ、ヘテロシクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アルキルカルボニル、ヘテロアリール、アリールオキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシアルキル、アミノ、ヒドロキシまたはカルボキシを表し、それらは全て、R<sub>10</sub>から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、R<sub>7</sub>は、水素、ハロゲンまたはオキソを表し；

R<sub>8</sub>は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルキニル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、ヘテロシクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アルキルカルボニル、ヘテロアリール、アリールオキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシアルキル、アミノ、ヒドロキシまたはカルボキシを表し、それらは全て、R<sub>10</sub>から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、R<sub>8</sub>は、水素、ハロゲンまたはオキソを表し；

R<sub>9</sub>は、水素、アルキル、ハロアルキルまたはヒドロキシアルキルを表し；

R<sub>10</sub>は、水素、アルキル、オキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、アミノ、アルコキシ、ハロアルキルまたはヒドロキシアルキルを表し；

R<sub>11</sub>は、水素、ハロゲン、シアノ、アミノ、アルキル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アミノ、シアノまたはアルコキシから選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基を表し；

R<sub>12</sub>は、アルキルアリール、アリールアルキル、カルボキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、カルバモイル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、複素環、アミノカルボニル、アルキルチオ、アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキシ、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルカルボニルオキシまたはアミノを表し、それらは全て、R<sub>8</sub>から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されてもよく；または、R<sub>12</sub>は水素を表し；

但し、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が同時にメチルであることはできないものとし；

R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>の両方が水素であるとき、R<sub>1</sub>はメチルまたは水素であることはできないものとする】。

#### **【請求項 27】**

皮膚疾患または症状が、増殖性および炎症性の皮膚疾患、乾癬、癌、表皮炎症、脱毛症、皮膚萎縮、ステロイド誘発性皮膚萎縮、皮膚老化、皮膚の光老化、ざ瘡、皮膚炎、アトピー性皮膚炎、脂漏性皮膚炎、接触皮膚炎、蕁麻疹、そう痒および湿疹から成る群から選択される請求項 26 に記載の医薬組成物。