

【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2月2日(2006.2.2)

【公表番号】特表2005-521676(P2005-521676A)

【公表日】平成17年7月21日(2005.7.21)

【年通号数】公開・登録公報2005-028

【出願番号】特願2003-565474(P2003-565474)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 249/08 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4196 (2006.01)**

**A 6 1 P 1/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 1/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 7/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 15/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 17/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 17/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 21/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/18 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/22 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**

**A 6 1 P 27/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 249/14 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 249/08 5 1 3

C 0 7 D 249/08 5 3 5

C 0 7 D 249/08 C S P

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 11/08  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 17/04  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 19/06  
 A 6 1 P 21/04  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/04  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 37/02  
 A 6 1 P 43/00  
 C 0 7 D 249/14 5 0 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年12月12日(2005.12.12)

## 【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

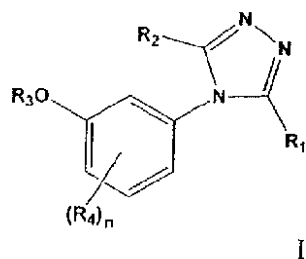
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式 I

【化1】



の化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

$R_1$  は、アリール、Het、( $C_1 \sim 7$ ) アルキルまたは( $C_3 \sim 12$ ) シクロアルキルであり、( $C_1 \sim 7$ ) アルキルまたは( $C_3 \sim 12$ ) シクロアルキルは、各々独立して、必要に応じて1～5個のアリール、Het、 $OR_a$ 、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_aR_b$ 、シアノ、 $CONR_aR_b$ 、 $CO_2R_a$ 、 $S(O)_mR_a$ 、 $S(O)_mNR_aR_b$  または  $P(=O)(OR_a)(R_a)$  で置換されており；

$R_2$  は、H、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $NR_c R_d$ 、アリール、Het、 $R_x - (C_{1-7})$ アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$ シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$ アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$ または $R_x - (CH_2CH_2S)_p$ であって；ここで $R_x$ は $SR_a$ 、 $NR_c R_d$ 、ピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、またはチオモルホリノであり；そしてpは1～7であり；

$R_3$  は、Hまたは $(C_{1-7})$ アルキルであり；

各 $R_4$  は、各々独立して、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_a R_b$ 、シアノ、 $CONR_a R_b$ 、 $CO_2 R_a$ 、 $SO_m R_a$ 、 $S(O)_m NR_a R_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$ アルキル、 $(C_{2-7})$ アルカノイル、 $(C_{2-7})$ アルカノイルオキシ、または $(C_{3-12})$ シクロアルキルであり；

$R_a$  および $R_b$  は、独立して、H、 $(C_{1-7})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $(C_{2-7})$ アルカノイル、 $(C_{2-7})$ アルカノイルオキシ、もしくはアリールであるか、または、 $R_a$  および $R_b$  は、これらに結合する窒素と一緒になってHetを形成し；

ここで、 $R^1$  または $R^2$  の任意のアリールまたはHetが、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_a R_b$ 、シアノ、 $CONR_a R_b$ 、 $CO_2 R_a$ 、 $SO_m R_a$ 、 $S(O)_m NR_a R_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$ アルキル、 $(C_{2-7})$ アルカノイル、 $(C_{2-7})$ アルカノイルオキシ、もしくは $(C_{3-12})$ シクロアルキルから独立して選択される1～4個の置換基で必要に応じて置換され；

mは0、1または2であり；

nは、0、1、2、3または4である、化合物。

#### 【請求項2】

請求項1に記載の化合物であって、ここで $R_2$  は、H、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $NR_c R_d$ 、アリールまたはHetであり； $R_c$  および $R_d$  は各々独立して $(C_{1-7})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $(C_{2-7})$ アルカノイル、 $(C_{2-7})$ アルカノイルオキシ、またはアリールであり；そして、nは0または1である、化合物。

#### 【請求項3】

$R_1$  がアリールである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項4】

$R_1$  が1～4個の置換基で置換されたアリールである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項5】

$R_1$  が1～4個の置換基で置換されたフェニルである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項6】

$R_1$  が1～3個の置換基で置換されたフェニルである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項7】

$R_1$  が1個のn-ブチル、イソブチル、メチル、エチルまたはtert-ブチルで置換されたフェニルである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項8】

$R_1$  がtert-ブチルで置換されたフェニルである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項9】

$R_1$  が2-tert-ブチルフェニル、3-tert-ブチルフェニル、または4-tert-ブチルフェニルである、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項10】

$R_1$  が3-tert-ブチルフェニル、または4-tert-ブチルフェニルである、請

求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

$R_1$  が 1 個の  $(C_{1-7})$  アルキルおよび  $(C_{1-7})$  アルコキシで置換されたフェニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

$R_1$  が 1 個の *tert*-ブチルおよびメトキシで置換されたフェニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

$R_1$  が *Het* である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

$R_1$  が 1 ~ 4 個の置換基で置換された *Het* である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R_2$  が H である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

$R_2$  が  $NR_c R_d$  である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

$R_2$  が  $(C_{1-7})$  アルキルまたは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルである、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

$R_2$  が  $NR_a R_b$  であり、ここで、 $R_a$  および  $R_b$  が、これらに結合する窒素と一緒になってピペラジノ環、ピロリジノ環、ピペリジノ環、モルホリノ環またはチオモルホリノ環を形成する、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 9】

$R_2$  がモルホリノ環またはチオモルホリノ環である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 0】

$R_2$  が H、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_c R_d$ 、アリール、*Het*、 $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $NR_c R_d$  であり；そして  $p$  は 1 ~ 7 である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 1】

$R_2$  が H、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_c R_d$ 、アリール、*Het*、 $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  はピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり；そして  $p$  は 1 ~ 7 である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 2】

$R_2$  が  $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $NH_2$  であり；そして  $p$  は 1 ~ 7 である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 3】

$R_2$  が  $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $SR_a$ 、 $NR_c R_d$ 、ピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり；そして  $p$  は 1 ~ 7 である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 4】

$R_2$  が  $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $NR_c R_d$  であり；そして  $p$  は 1 ~ 7 である、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 25】

$R_3$  が H である、請求項 1 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

$R_3$  が  $(C_{1-7})$  アルキルである、請求項 1 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

$R_3$  がメチルである、請求項 1 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 28】

$R_3$  がエチルである、請求項 1 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 29】

$R_3$  が *tert*-ブチルである、請求項 1 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

$n$  が 0 である、請求項 1 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

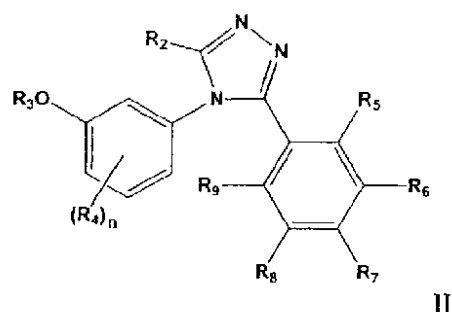
【請求項 31】

$n$  が 1 である、請求項 1 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 32】

以下の式 II

【化 2】



II

の化合物またはその薬学的に受容可能な塩である、請求項 1 に記載の化合物であって、ここで：

$R_2$  は、H、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_c R_d$ 、アリール、Het、 $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $SR_a$ 、 $NR_c R_d$ 、ピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり；そして  $p$  は 1 ~ 7 であり；

$R_3$  は、H または  $(C_{1-7})$  アルキルであり；

各  $R_4$  は、独立して、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_a R_b$ 、シアノ、 $CONR_a R_b$ 、 $CO_2 R_a$ 、 $SO_m R_a$ 、 $S(O)_m NR_a R_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシまたは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルであり；

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$  および  $R_9$  は、各々独立して、H、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_a R_b$ 、シアノ、 $CONR_a R_b$ 、 $CO_2 R_a$ 、 $SO_m R_a$ 、 $S(O)_m NR_a R_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシまたは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルであり；

$R_a$  および  $R_b$  は、各々独立して、H、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシもしくはアリールであるか、または、 $R_a$  および  $R_b$  が、これらに結合する窒素と一緒にあって Het を

形成し；

ここで、 $R_2$  の任意のアリールまたは  $Het$  が、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_aR_b$ 、シアノ、 $CONR_aR_b$ 、 $CO_2R_a$ 、 $SO_mR_a$ 、 $S(O)_mNR_aR_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシ、もしくは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルから独立して選択される 1～4 個の置換基で必要に応じて置換され；

$m$  は 0、1 または 2 であり；

$n$  は、0、1、2、3 または 4 である、化合物。

【請求項 33】

請求項 32 に記載の化合物であって、ここで  $R_2$  は、 $H$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_cR_d$ 、アリールまたは  $Het$  であり； $R_c$  および  $R_d$  は各々独立して  $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシ、またはアリールであり；そして、 $n$  は 0 または 1 である、化合物。

【請求項 34】

$R_2$  が  $H$  である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 35】

$R_2$  が  $NR_cR_d$  である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 36】

$R_2$  が  $(C_{1-7})$  アルキルまたは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルである、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 37】

$R_2$  がピペラジノ環、ピロリジノ環、ピペリジノ環、モルホリノ環またはチオモルホリノ環である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 38】

$R_2$  がモルホリノ環またはチオモルホリノ環である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 39】

$R_2$  が  $H$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_cR_d$ 、アリールまたは  $Het$  である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 40】

$R_2$  が  $H$ 、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_cR_d$ 、アリール、 $Het$ 、 $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $NR_cR_d$  であり；そして  $p$  は 1～7 である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 41】

$R_2$  が  $H$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_cR_d$ 、アリール、 $Het$ 、 $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  はピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり；そして  $p$  は 1～7 である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 42】

$R_2$  が  $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は 1 個以上の塩基性原子を含む基であり；そして  $p$  は 1～7 である、請求項 32 または 33 に記載の化合物。

【請求項 43】

$R_2$  が  $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；

あって；ここで $R_x$ は $OR_a$ 、 $SR_a$ 、 $NR_c R_d$ 、ピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり；そして $p$ は1～7である、請求項32または33に記載の化合物。

【請求項44】

$R_2$ が $R_x - (C_{1-7})$ アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$ シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$ アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$ または $R_x - (CH_2CH_2S)_p$ であって；ここで $R_x$ は $NR_c R_d$ であり；そして $p$ は1～7である、請求項32に記載の化合物。

【請求項45】

$R_2$ が $R_x - (C_{1-7})$ アルキルまたは $NR_c R_d$ であり、ここで $R_x$ は $NR_c R_d$ であり；そして、 $R_3$ はHである、請求項1または32に記載の化合物

【請求項46】

$R_3$ がHである、請求項32～44のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項47】

$R_3$ が $(C_{1-7})$ アルキルである、請求項32～44のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項48】

$R_3$ がメチルである、請求項32～44のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項49】

$R_3$ がエチルである、請求項32～44のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項50】

$R_3$ がtert-ブチルである、請求項32～44のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項51】

$n$ が0である、請求項32～49のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項52】

$n$ が1である、請求項32～49のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項53】

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ または $R_9$ が、 $(C_{1-7})$ アルキル、または $(C_{3-12})$ シクロアルキルである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項54】

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ または $R_9$ が $(C_{1-7})$ アルコキシである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項55】

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ または $R_9$ が $OCH_3$ である、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項56】

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ または $R_9$ がtert-ブチルである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項57】

$R_5$ がtert-ブチルである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項58】

$R_6$ がtert-ブチルである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項59】

$R_7$ がtert-ブチルである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項60】

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ または $R_9$ がOHである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項61】

$R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ または $R_9$ がハロである、請求項32～52のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項62】

R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub> または R<sub>9</sub> が NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、(C<sub>2</sub>～7) アルカノイルオキシ、または (C<sub>3</sub>～12) シクロアルキルである、請求項 32～52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 63】

R<sub>5</sub> が OCH<sub>3</sub> であり、かつ R<sub>8</sub> または R<sub>9</sub> が tert-ブチルである、請求項 32～52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 64】

R<sub>5</sub> が OH であり、かつ R<sub>8</sub> または R<sub>9</sub> が tert-ブチルである、請求項 32～52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 65】

R<sub>5</sub> または R<sub>6</sub> が OCH<sub>3</sub> であり、かつ R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub> または R<sub>9</sub> が tert-ブチルである、請求項 32～52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 66】

R<sub>5</sub> または R<sub>6</sub> が OH であり、かつ R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub> または R<sub>9</sub> が tert-ブチルである、請求項 32～52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 67】

請求項 1 に記載の化合物であって、

1 - { 3 - [ 4 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - メトキシベンゼン ;

1 - { 3 - [ 4 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - フェノール ;

1 - { 3 - [ 5 - ( tert-ブチル ) - 2 - メトキシフェニル ] ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - メトキシベンゼン ;

1 - { 3 - [ 5 - ( tert-ブチル ) - 2 - ヒドロキシフェニル ] - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - フェノール ;

1 - { 3 - [ 3 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - メトキシベンゼン ;

1 - { 3 - [ 3 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - フェノール ; もしくは

1 - { 3 - [ 5 - ( tert-ブチル ) - 2 - メトキシフェニル ] ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - フェノール ;

またはその薬学的に受容可能な塩である、化合物。

【請求項 68】

請求項 1 に記載の化合物であって、

1 - { 3 - [ 4 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - 5 - N , N - ジメチルアミノ - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - メトキシベンゼン ;

1 - { 3 - [ 4 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - 5 - N , N - ジメチル - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - フェノール ; もしくは

1 - { 3 - [ 4 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - 5 - N , N - ジメチルアミノエチル - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - メトキシベンゼン ;

またはその薬学的に受容可能な塩である、化合物。

【請求項 69】

請求項 1 に記載の化合物であって、

1 - { 3 - [ 3 - ( tert-ブチル ) フェニル ] - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) } - 3 - フェノール ;

またはその薬学的に受容可能な塩である、化合物。

【請求項 70】

薬学的に受容可能な希釈剤またはキャリアと組み合わせて、請求項 1～69 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する、薬学的組成物。

【請求項 71】



オピオイドレセプターを阻害するための組成物であって、請求項 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項 72】

オピオイドレセプターの活性を調節するための組成物であって、請求項 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載の化合物の有効調節量を含む、組成物。

【請求項 73】

哺乳動物において疼痛を処置するための組成物であって、該哺乳動物に対して有効な量の請求項 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 74】

医学的治療における用途のための、請求項 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 75】

疼痛の処置に有用な医薬の製造のための、請求項 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

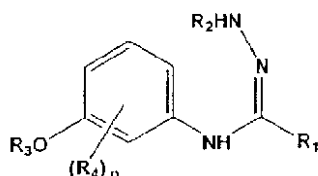
【請求項 76】

オピオイドレセプターの活性を調節するために有用な医薬の製造のための、請求項 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 77】

以下の式 I I I

【化 3】



III

の化合物であって、ここで：

$R_1$  は、アリール、Het、 $(C_{1-7})$  アルキルまたは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルであり、 $(C_{1-7})$  アルキルまたは  $(C_{3-12})$  シクロアルキルは、互いに独立して、必要に応じて 1 ~ 5 個のアリール、Het、 $OR_a$ 、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_aR_b$ 、シアノ、 $CONR_aR_b$ 、 $CO_2R_a$ 、 $SO_mR_a$ 、 $S(O)_mNR_aR_b$  または  $P(=O)(OR_a)(R_a)$  で置換されており；

$R_2$  は、H、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $NR_cR_d$ 、アリール、Het、 $R_x - (C_{1-7})$  アルキル、 $R_x - (C_{3-12})$  シクロアルキル、 $R_x - (C_{2-7})$  アルコキシ、 $R_x - (CH_2CH_2O)_p$  または  $R_x - (CH_2CH_2S)_p$  であって；ここで  $R_x$  は  $SR_a$ 、 $NR_cR_d$ 、ピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり；そして  $p$  は 1 ~ 7 であり；

$R_3$  は、H または  $(C_{1-7})$  アルキルであり；

各  $R_4$  は、独立して、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_aR_b$ 、シアノ、 $CONR_aR_b$ 、 $CO_2R_a$ 、 $SO_mR_a$ 、 $S(O)_mNR_aR_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシ、または  $(C_{3-12})$  シクロアルキルであり；

$R_a$  および  $R_b$  は、各々独立して、H、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{3-12})$  シクロアルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシ、もしくはアリールであるか、または、 $R_a$  および  $R_b$  は、これらに結合する窒素と一緒にあって Het を形成し；

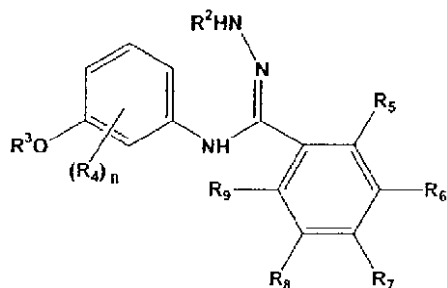
ここで、 $R^2$  の任意のアリールまたは Het が、 $OR_a$ 、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、 $NO_2$ 、 $NR_aR_b$ 、シアノ、 $CONR_aR_b$ 、 $CO_2R_a$ 、 $SO_mR_a$ 、 $S(O)_mNR_aR_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_{1-7})$  アルキル、 $(C_{2-7})$  アルカノイル、 $(C_{2-7})$  アルカノイルオキシ、または  $(C_{3-12})$

- ) シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で必要に応じて置換され ;  
 m は 0、1 または 2 であり ;  
 n は、0、1、2、3 または 4 である、化合物。

## 【請求項 7 8】

以下の式 I V

## 【化 4】



III

の化合物であって、ここで：

R<sub>2</sub> は、H、(C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキル、NR<sub>c</sub> R<sub>d</sub>、アリール、Het、R<sub>x</sub> - (C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、R<sub>x</sub> - (C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキル、R<sub>x</sub> - (C<sub>2</sub> ~ 7) アルコキシ、R<sub>x</sub> - (CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> O)<sub>p</sub> または R<sub>x</sub> - (CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> S)<sub>p</sub> であって ; ここで R<sub>x</sub> は SR<sub>a</sub>、NR<sub>c</sub> R<sub>d</sub>、ピペラジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノまたはチオモルホリノであり ; そして p は 1 ~ 7 であり ;

R<sub>3</sub> は、H または (C<sub>1</sub> ~ 7) アルキルであり ;

各 R<sub>4</sub> 独立して、OR<sub>a</sub>、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、NO<sub>2</sub>、NR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、シアノ、CONR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、CO<sub>2</sub> R<sub>a</sub>、SO<sub>m</sub> R<sub>a</sub>、S(O)<sub>m</sub> NR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、P(=O)(OR<sub>a</sub>)(R<sub>a</sub>)、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイルオキシまたは (C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキルであり ;

R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub> および R<sub>9</sub> は、各々独立して、H、OR<sub>a</sub>、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、NO<sub>2</sub>、NR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、シアノ、CONR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、CO<sub>2</sub> R<sub>a</sub>、SO<sub>m</sub> R<sub>a</sub>、S(O)<sub>m</sub> NR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、P(=O)(OR<sub>a</sub>)(R<sub>a</sub>)、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイルオキシまたは (C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキルであり ;

R<sub>a</sub> および R<sub>b</sub> は、各々独立して、H、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイルオキシもしくはアリールであるか、または、R<sub>a</sub> および R<sub>b</sub> が、これらに結合する窒素と一緒になって Het を形成し ;

R<sub>c</sub> および R<sub>d</sub> は、各々独立して、H、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイルオキシもしくはアリールであり ;

ここで、R<sup>2</sup> の任意のアリールまたは Het が、OR<sub>a</sub>、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、NO<sub>2</sub>、NR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、シアノ、CONR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、CO<sub>2</sub> R<sub>a</sub>、SO<sub>m</sub> R<sub>a</sub>、S(O)<sub>m</sub> NR<sub>a</sub> R<sub>b</sub>、P(=O)(OR<sub>a</sub>)(R<sub>a</sub>)、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイル、(C<sub>2</sub> ~ 7) アルカノイルオキシ、もしくは (C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で必要に応じて置換され ;  
 m は 0、1 または 2 であり ;  
 n は、0、1、2、3 または 4 である、化合物。

## 【請求項 7 9】

請求項 7 4 に記載の化合物であって、ここで R<sub>2</sub> は、H、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキル、NR<sub>c</sub> R<sub>d</sub>、アリールまたは Het であり ; R<sub>c</sub> および R<sub>d</sub> は各々独立して H、(C<sub>1</sub> ~ 7) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ 12) シクロアルキル、(C<sub>2</sub> ~ 7)

アルカノイル、(C<sub>2</sub> - 7) アルカノイルオキシ、またはアリールであり；そして、n は 0 または 1 である、化合物。