

【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 07 D 249/08	(2006.01)
A 61 K 31/4196	(2006.01)
A 61 P 1/02	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 7/06	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 11/02	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 11/08	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 17/04	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 19/06	(2006.01)
A 61 P 21/04	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 249/14	(2006.01)

【F I】

C 07 D 249/08	5 1 3
C 07 D 249/08	5 3 5
C 07 D 249/08	C S P
A 61 K 31/4196	
A 61 P 1/02	
A 61 P 1/04	
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/10	
A 61 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

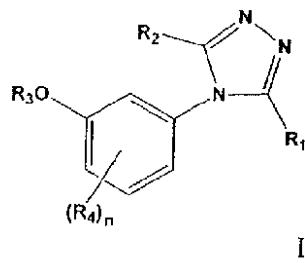
【補正の内容】

【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：

R₁は、アリール、H e t、(C₁~₇)アルキルまたは(C₃~₁₂)シクロアルキルであり、(C₁~₇)アルキルまたは(C₃~₁₂)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、H e t、O R_a、ハロ、N O₂、N R_a R_b、シアノ、C O N R_a R_b、C O₂ R_a、S(O)_m R_a、S(O)_m N R_a R_bまたはP(=O)(O R_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、 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_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、 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_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 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_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 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 - プチル、 イソブチル、 メチル、 エチルまたは $tert$ - プ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 $tert$ - プ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 $2-tert$ - プチルフェニル、 $3-tert$ - プチルフェニル、 または $4-tert$ - プ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 $3-tert$ - プチルフェニル、 または $4-tert$ - プ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11】

R_1 が1個の($C_{1\sim 7}$)アルキルおよび($C_{1\sim 7}$)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12】

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13】

R_1 がHettである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項14】

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

【請求項15】

R_2 がH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16】

R_2 が NR_cR_d 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17】

R_2 が($C_{1\sim 7}$)アルキルまたは($C_{3\sim 12}$)シクロアルキルである、請求項1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項18】

R_2 が NR_aR_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あってピペラジノ環、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1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項19】

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1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

R_2 がH、($C_{3\sim 12}$)シクロアルキル、 NR_cR_d 、アリール、Hett、 $R_x-(C_{1\sim 7})$ アルキル、 $R_x-(C_{3\sim 12})$ シクロアルキル、 $R_x-(C_{2\sim 7})$ 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1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項21】

R_2 がH、($C_{1\sim 7}$)アルキル、($C_{3\sim 12}$)シクロアルキル、 NR_cR_d 、アリール、Hett、 $R_x-(C_{1\sim 7})$ アルキル、 $R_x-(C_{3\sim 12})$ シクロアルキル、 $R_x-(C_{2\sim 7})$ 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1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項22】

R_2 が $R_x-(C_{1\sim 7})$ アルキル、 $R_x-(C_{3\sim 12})$ シクロアルキル、 $R_x-(C_{2\sim 7})$ 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1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項23】

R_2 が $R_x-(C_{1\sim 7})$ アルキル、 $R_x-(C_{3\sim 12})$ シクロアルキル、 $R_x-(C_{2\sim 7})$ 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である、請求項1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項24】

R_2 が $R_x - (C_1 \sim 7)$ アルキル、 $R_x - (C_3 \sim 12)$ シクロアルキル、 $R_x - (C_2 \sim 7)$ 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 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 $(C_1 \sim 7)$ 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。

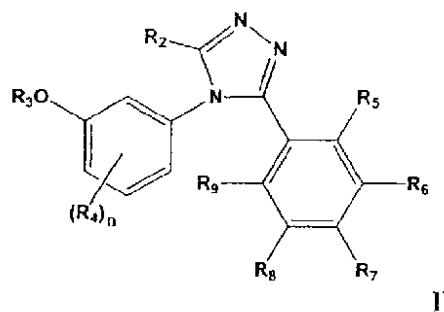
【請求項 31】

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】



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、 $(C_3 \sim 12)$ シクロアルキル、 NR_cR_d 、アリール、 Het 、 $R_x - (C_1 \sim 7)$ アルキル、 $R_x - (C_3 \sim 12)$ シクロアルキル、 $R_x - (C_2 \sim 7)$ 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 $(C_1 \sim 7)$ 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 、 $S(O)_mNR_aR_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_1 \sim 7)$ アルキル、 $(C_2 \sim 7)$ アルカノイル、 $(C_2 \sim 7)$ アルカノイルオキシまたは $(C_3 \sim 12)$ 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_aR_b 、シアノ、 $CONR_aR_b$ 、 CO_2R_a 、 SO_mR_a 、 $S(O)_mNR_aR_b$ 、 $P(=O)(OR_a)(R_a)$ 、 $(C_1 \sim 7)$ アルキル、 $(C_2 \sim 7)$ アルカノイル、 $(C_2 \sim 7)$ アルカノイルオキシまたは $(C_3 \sim 12)$ 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、 $(C_1 \sim 7)$ アルキル、 $(C_3 \sim 12)$ シクロアルキル、 $(C_2 \sim 7)$ アルカノイル、 $(C_2 \sim 7)$ 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になって 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 3 3】

請求項 3 2 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 3 4】

R_2 が H である、請求項 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

R_2 が NR_cR_d である、請求項 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 7】

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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 4 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 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 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 4 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 OR_a 、 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 である、請求項 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 4 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_cR_d であり；そして p は 1 ~ 7 である、請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

R_2 が $R_x - (C_{1~7})$ アルキルまたは NR_cR_d であり、ここで R_x は NR_cR_d であり；そして、 R_3 は H である、請求項 1 または 3 2 に記載の化合物

【請求項 4 6】

R_3 が H である、請求項 3 2 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 7】

R_3 が $(C_{1~7})$ アルキルである、請求項 3 2 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 8】

R_3 がメチルである、請求項 3 2 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 9】

R_3 がエチルである、請求項 3 2 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 0】

R_3 が tert - ブチルである、請求項 3 2 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 1】

n が 0 である、請求項 3 2 ~ 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 2】

n が 1 である、請求項 3 2 ~ 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 3】

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 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 4】

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 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 5】

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 または R_9 が OCH_3 である、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 6】

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 または R_9 が tert - ブチルである、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 7】

R_5 が tert - ブチルである、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 8】

R_6 が tert - ブチルである、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 9】

R_7 が tert - ブチルである、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 0】

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 または R_9 が OH である、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 1】

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 または R_9 がハロである、請求項 3 2 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 2】

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 または R_9 が NO_2 、 NH_2 、(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_5 が OCH_3 であり、かつ 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64】

R_5 が OH であり、かつ 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65】

R_5 または R_6 が OCH_3 であり、かつ 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66】

R_5 または R_6 が OH であり、かつ 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 - フエノール ;

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 - フエノール ;

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 - フエノール ; 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 - フエノール ;

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 - フエノール ; 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 - フエノール ;

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。

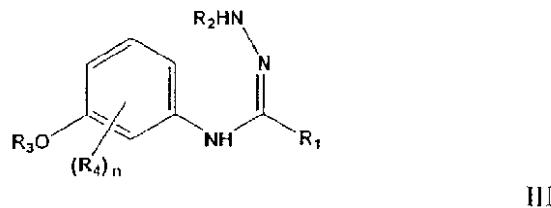
【請求項76】

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III

【化3】



の化合物であって、ここで：

R₁は、アリール、H e t、(C₁～₇)アルキルまたは(C₃～₁₂)シクロアルキルであり、(C₁～₇)アルキルまたは(C₃～₁₂)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、H e t、O R_a、ハロ、N O₂、N R_a R_b、シアノ、C O N R_a R_b、C O₂ R_a、S O_m R_a、S (O)_m N R_a R_bまたはP(=O)(O R_a)(R_a)で置換されており；

R₂は、H、(C₃～₁₂)シクロアルキル、N R_c R_d、アリール、H e t、R_x-(C₁～₇)アルキル、R_x-(C₃～₁₂)シクロアルキル、R_x-(C₂～₇)アルコキシ、R_x-(C H₂ C H₂ O)_pまたはR_x-(C H₂ C H₂ S)_pであって；ここでR_xはS R_a、N R_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；

R₃は、Hまたは(C₁～₇)アルキルであり；

各R₄は、独立して、O R_a、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、N O₂、N R_a R_b、シアノ、C O N R_a R_b、C O₂ R_a、S O_m R_a、S (O)_m N R_a R_b、P(=O)(O R_a)(R_a)、(C₁～₇)アルキル、(C₂～₇)アルカノイル、(C₂～₇)アルカノイルオキシ、または(C₃～₁₂)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、(C₁～₇)アルキル、(C₃～₁₂)シクロアルキル、(C₂～₇)アルカノイル、(C₂～₇)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になってH e tを形成し；

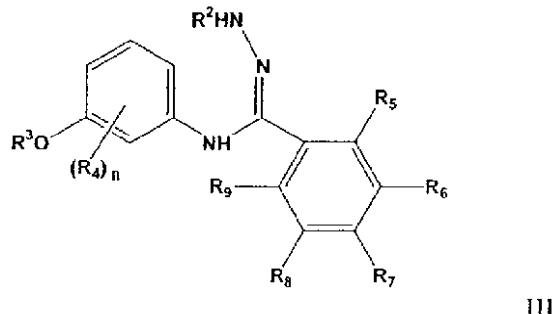
ここで、R²の任意のアリールまたはH e tが、O R_a、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、ハロ、N O₂、N R_a R_b、シアノ、C O N R_a R_b、C O₂ R_a、S O_m R_a、S (O)_m N R_a R_b、P(=O)(O R_a)(R_a)、(C₁～₇)アルキル、(C₂～₇)アルカノイル、(C₂～₇)アルカノイルオキシ、または(C₃～₁₂)

) 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】



の化合物であって、ここで：

R_2 は、H、(C₃ ~ 1~2) シクロアルキル、NR_cR_d、アリール、Het、R_x - (C₁ ~ 7) アルキル、R_x - (C₃ ~ 1~2) シクロアルキル、R_x - (C₂ ~ 7) アルカキシ、R_x - (CH₂CH₂O)_p または R_x - (CH₂CH₂S)_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 (C₁ ~ 7) アルキルであり；

各 R_4 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、NO₂、NR_aR_b、シアノ、CONR_aR_b、CO₂R_a、SO_mR_a、S(O)_mNR_aR_b、P(=O)(OR_a)(R_a)、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₂ ~ 7) アルカノイル、(C₂ ~ 7) アルカノイルオキシまたは(C₃ ~ 1~2) 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、NO₂、NR_aR_b、シアノ、CONR_aR_b、CO₂R_a、SO_mR_a、S(O)_mNR_aR_b、P(=O)(OR_a)(R_a)、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₂ ~ 7) アルカノイル、(C₂ ~ 7) アルカノイルオキシまたは(C₃ ~ 1~2) 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、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₃ ~ 1~2) シクロアルキル、(C₂ ~ 7) アルカノイル、(C₂ ~ 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になって Het を形成し；

R_c および R_d は、各々独立して、H、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₃ ~ 1~2) シクロアルキル、(C₂ ~ 7) アルカノイル、(C₂ ~ 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^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、NO₂、NR_aR_b、シアノ、CONR_aR_b、CO₂R_a、SO_mR_a、S(O)_mNR_aR_b、P(=O)(OR_a)(R_a)、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₂ ~ 7) アルカノイル、(C₂ ~ 7) アルカノイルオキシ、もしくは(C₃ ~ 1~2) 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_2 は、H、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₃ ~ 1~2) 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 H、(C₁ ~ 7) アルキル、(C₃ ~ 1~2) シクロアルキル、(C₂ ~ 7)

アルカノイル、(C₂ ~ 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。