

【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1月12日(2006.1.12)

【公表番号】特表2001-527068(P2001-527068A)

【公表日】平成13年12月25日(2001.12.25)

【出願番号】特願2000-526490(P2000-526490)

【国際特許分類】

C 07 D 211/58 (2006.01)
A 61 K 31/445 (2006.01)
A 61 K 31/4525 (2006.01)
A 61 K 31/4535 (2006.01)
A 61 K 31/4545 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 1/12 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 25/04 (2006.01)
A 61 P 25/18 (2006.01)
A 61 P 25/30 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
C 07 D 401/06 (2006.01)
C 07 D 405/06 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
C 07 D 409/06 (2006.01)

【F I】

C 07 D 211/58
A 61 K 31/445
A 61 K 31/4525
A 61 K 31/4535
A 61 K 31/4545
A 61 K 31/5377
A 61 P 1/04
A 61 P 1/12
A 61 P 9/00
A 61 P 11/00
A 61 P 25/04
A 61 P 25/18
A 61 P 25/30
A 61 P 29/00
A 61 P 37/06
C 07 D 401/06
C 07 D 405/06
C 07 D 405/12
C 07 D 409/06

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月8日(2005.11.8)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

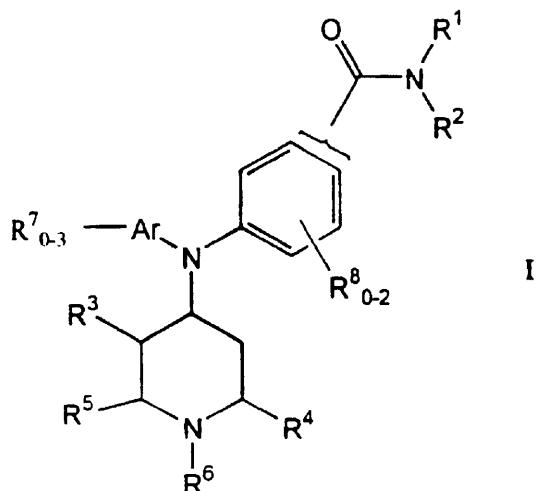
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】一般式：

【化1】



上式中

Ar は、それぞれ 1 ないし 3 個の R^7 で場合によっては置換されるフェニル、1 - ナフチルもしくは 2 - ナフチルであり；

R^1 および R^2 は、水素、 C_{1-8} アルキル；ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシもしくはトリフルオロメチルで場合によっては一、二もしくは三置換されるフェニル；またはハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシもしくはトリフルオロメチルで場合によっては一、二もしくは三置換されるベンジルより成る群から独立に選択されるか、あるいは代わりに、 R^1 および R^2 はそれらの結合する N と一緒にになって、ピロリジニル、モルホリニル、ペリジニルおよびヘキサメチレンイミニルより成る群から選択される環を形成し、各前記環は 1 ないし 4 個のメチル基で場合によっては置換されていてもよく；

R^3 、 R^4 および R^5 は水素および C_{1-4} アルキルから独立に選択され；

R^6 は、水素； C_{1-8} アルキル； C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} アルケニル； C_{1-6} アルコキシ C_{1-3} アルキル；4 - C_{1-4} アルキル - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - オキソ - 1 H - トレトラゾル - 1 - イル C_{1-4} アルキル；チエン - 2 - イル C_{1-4} アルキル；チエン - 3 - イル C_{1-4} アルキル；フラン - 2 - イル C_{1-4} アルキル；フラン - 3 - イル C_{1-4} アルキル；ピロル - 2 - イル C_{1-4} アルキル；

ピロル - 3 - イル C_{1-4} アルキル；ビリジン - 2 - イル C_{1-4} アルキル；ビリジン - 3 - イル C_{1-4} アルキル；ビリジン - 4 - イル C_{1-4} アルキル；ピラジニル C_{1-4} アルキル；ピリミジン - 2 - イル C_{1-4} アルキル；ピリミジン - 4 - イル C_{1-4} アルキル；ピリミジン - 5 - イル C_{1-4} アルキル；チアゾル - 2 - イル C_{1-4} アルキル；チアゾル - 4 - イル C_{1-4} アルキル；チアゾル - 5 - イル C_{1-4} アルキル；オキサゾル - 2 - イル C_{1-4} アルキル；オキサゾル - 4 - イル C_{1-4} アルキル；オキサゾル - 5 - イル C_{1-4} アルキルおよびフェニル C_{1-4} アルキルより成る群から選択され、ここで前述のチエニル、フラニル、ピロリル、チアゾリルおよびオキサゾリルは非縮合の R^7 で場合によっては一、二もしくは三置換され、また、前述のピリジニル、ピラジニル、ピリミジニルおよびフェニルは R^7 で場合によっては一、二もしくは三置換され；

R^7 は、ヒドロキシ、ハロ、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} アシル、 C_{1-3} アシリルオキシ、シアノ、アミノ、 C_{1-3} アシリルアミノ、 C_{1-3} アルキルアミノ、ジ (C_{1-3} アル

キル)アミノ、 C_{1-3} アルキルチオ、 C_{1-3} アルキルスルホニル、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシより成る群から独立に選択され、また、2個のR⁷は、Arの隣接する炭素原子に結合された- $(CH_2)_{3-5}$ -および-O($CH_2)_{1-3}O$ -より成る群から選択される單一の部分を一緒に形成することができ；そして

R⁸は、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシおよびトリフルオロメチルより成る群から独立に選択される。

で表される -オピオイドレセプターに結合する化合物。

【請求項2】 Arがフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項3】 R¹およびR²が、水素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、i-ブチル、フェニル、p-クロロフェニル、p-フルオロフェニル、p-メチルフェニル、p-トリフルオロメチルフェニル、ベンジル、p-クロロベンジル、p-フルオロベンジル、p-メチルベンジルおよびp-トリフルオロメチルベンジルより成る群から独立に選択されるか、または代わりに、R¹およびR²が、それらの結合するNと一緒になってピロリジニルおよびピペリジニルより成る群から選択される環を形成する、請求項1記載の化合物。

【請求項4】 R³、R⁴およびR⁵が、水素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルおよびt-ブチルから独立に選択される、請求項1記載の化合物。

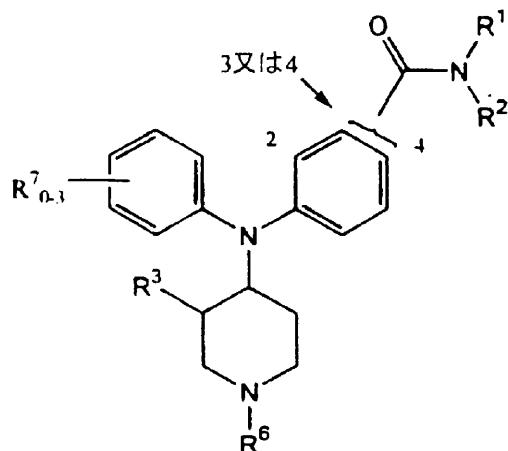
【請求項5】 R⁶が、水素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、シクロプロピルメチル、エテニル、アリル、メトキシメチル、ベンジル、p-クロロベンジル、p-フルオロベンジル、p-メチルベンジル、p-トリフルオロメチルベンジル、p-アミノベンジル、チエン-2-イル CH_2CH_2 -、チエン-3-イル CH_2CH_2 -、ピリジン-3-イル CH_2CH_2 -、ピリジン-4-イル CH_2CH_2 -、チアゾル-2-イル CH_2CH_2 -およびフェニル CH_2CH_2 -より成る群から選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項6】 R⁷が、ヒドロキシ、クロロ、ブロモ、フルオロ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、メトキシ、エトキシ、ホルミル、アシル、アセトキシ、シアノ、アミノ、メチルアミド、メチルアミノ、N,N-ジメチルアミノ、メチルチオ、メチルスルホニル、トリフルオロメトキシおよびトリフルオロメチル、ならびに、2個のR⁷が一緒にプロピレン、ブチレンおよび-O CH_2O -より成る群から選択される單一の部分を形成する好ましい部分より成る群から独立に選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項7】 R⁸が、クロロ、ブロモ、フルオロ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、t-ブチル、メトキシ、エトキシおよびトリフルオロメチルより成る群から独立に選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項8】 一般構造式：

【化2】



上式中、R¹、R²、R³、R⁶およびR⁷が：

【表1】

化合物番号	R ⁷	R ⁶	R ¹	R ²	アミド置換	R ³
P1	なし	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P2	なし	-CH ₂ —△—	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P3	3-OH	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P4	3-OH	-CH ₂ —△—	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H

【表2】

P5	3-OH	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P6	3-OH	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P7	3-OH	-CH ₂ CH ₂ Ph	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P8	3-OH	-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P9	3-OH	-CH ₂ CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P10	3-OH	-CH ₂ CH ₂ Ph	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P11	3-OH	-CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P12	3-OH	-CH ₂ CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P13	3-OH	-CH ₂ CH ₂ Ph	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P14	なし	-CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P15	なし	-CH ₂ CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P16	なし	-CH ₂ CH ₂ Ph	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P17	3-F	-CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P18	3-F	-CH ₂ CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P19	3-F	-CH ₂ CH ₂ Ph	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P20	3-OCH ₃	-CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P21	3-OCH ₃	-CH ₂ CH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P22	3-OCH ₃	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P23	3,4-OCH ₂ O-	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P24	3,4-OCH ₂ O-	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P25	3,4-OCH ₂ O-	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P26	3,4-OCH ₂ O-	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P27	3-N(CH ₃) ₂	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P28	3-N(CH ₃) ₂	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P29	3-N(CH ₃) ₂	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P30	3-N(CH ₃) ₂	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P31	4-F	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P32	4-F	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P33	4-F	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P34	4-F	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P35	2-F	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P36	2-F	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H

【表3】

P37	2-F	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P38	2-F	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P39	3-Cl, 4-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P40	3-Cl, 4-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P41	3-Cl, 4-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P42	3-Cl, 4-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P43	3-CF ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P44	3-CF ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P45	3-CF ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P46	3-CF ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P47	3-OCH ₃ , 5-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P48	3-OCH ₃ , 5-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P49	3-OCH ₃ , 5-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P50	3-OCH ₃ , 5-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P51	3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P52	3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P53	3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P54	3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P55	4-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P56	4-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P57	4-CH ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P58	4-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P59	2-CH ₃ , 3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P60	2-CH ₃ , 3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P61	2-CH ₃ , 3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P62	2-CH ₃ , 3-CH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P63	3-OCF ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P64	3-OCF ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P65	3-OCF ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P66	3-OCF ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P67	3-SCH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P68	3-SCH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H

【表4】

P69	3-SCH ₃	-nC ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	2-C ₃ H ₇	4	H
P70	3-SCH ₃	-nC ₃ H ₇	-nC ₄ H ₉	-nC ₄ H ₉	4	H
P71	なし	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P72	なし	-H	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P73	なし	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P74	なし	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P75	3-OCH ₃	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P76	3-OCH ₃	-H	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P77	3-OCH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P78	3-OCH ₃	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P79	なし	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	tr-Me
P80	なし	-H	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	tr-Me
P81	なし	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	tr-Me
P82	なし	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	tr-Me
P83	なし	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P84	なし	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	3	H
P85	なし	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH ₃	3	H
P86	なし	-nC ₃ H ₇		-(CH ₂) ₅ -	3	H
P87	* 2,3-	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	3	H
	CH=CHCH=CH-					
P88	* 2,3-	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
	CH=CHCH=CH-					
P89	3,4-(CH ₂) ₄ -	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P90	3,4-(CH ₂) ₄ -	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P91	3,4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-nC ₃ H ₇	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P92	3,4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P93	なし		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P94	m-F		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H

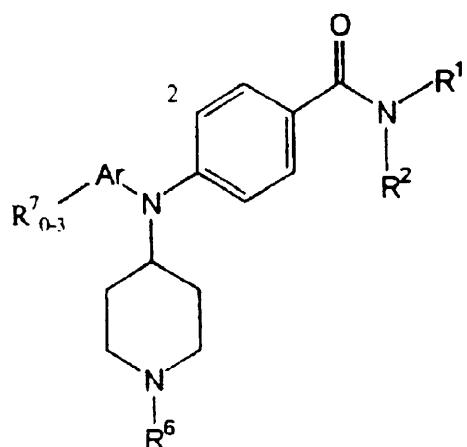
【表5】

P95	m-sCH ₃		-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P96	なし		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P97	m-oCH ₃		-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P98	m-OH		-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	tr-Me
P99	なし		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P100	o-F		-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P101	o-CH ₃		-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	ci-Me
P102	なし		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P103	p-OH		-CH ₂ CH ₃	-nC ₃ H ₇	4	H
P104	p-F		-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	tr-Me
P105	なし		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P106	m-sCH ₃		-nC ₃ H ₇	-nC ₃ H ₇	4	H
P107	m-oCF ₃		-CH ₃	-nC ₃ H ₇	4	ci-Me
P108	なし		-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P109	m-CH ₃		-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	4	H
P110	2, 3-oCH ₃		-CH ₃	-nC ₃ H ₇	4	H

より成る群から他に従属的に選択される、
を有する請求項1記載の化合物。

【請求項8】一般構造式：

【化3】



上式中、 R^1 、 R^2 、 R^6 および R^7 - Ar が：

【表 6】

化合物番号	R^7 - Ar	R^6	R^1	R^2
C1	3-CH ₃ O-Ph	1-フ [°] ヒ ^ル	エチル	エチル
C2	3-HO-Ph	1-フ [°] ヒ ^ル	エチル	エチル
C3	Ph	1-フ [°] ヒ ^ル	エチル	エチル
C4	Ph	1-フ [°] ヒ ^ル	メチル	Ph
C5	3-Cl-Ph	1-フ [°] ヒ ^ル	エチル	エチル
C6	3-Cl-Ph	1-フ [°] ヒ ^ル		-(CH ₂) ₄ -
C7	2-CH ₃ O-Ph	1-フ [°] ヒ ^ル	エチル	エチル
C8	1-ナフチル	1-フ [°] ヒ ^ル	エチル	エチル
C9	1-ナフチル	1-フ [°] ヒ ^ル		-(CH ₂) ₄ -
C10	Ph	メチル	エチル	エチル
C11	Ph	メチル	1-フ [°] ヒ ^ル	1-フ [°] ヒ ^ル
C12	Ph	メチル	メチル	エチル
C13	Ph	メチル	2-フ [°] ヒ ^ル	2-フ [°] ヒ ^ル
C14	Ph	メチル		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -
C15	Ph	メチル		-(CH ₂) ₃ -
C16	Ph	メチル		-(CH ₂) ₄ -

【表 7】

C17	3-CH ₃ O-Ph	メル	エチル	エチル
C18	3-CH ₃ O-Ph	メル	1-フロピル	1-フロピル
C19	3-CH ₃ O-Ph	メル	メル	エチル
C20	3-CH ₃ O-Ph	メル	2-フロピル	2-フロピル
C21	3-CH ₃ O-Ph	メル	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
C22	3-CH ₃ O-Ph	メル		-(CH ₂) ₃ -
C23	3-CH ₃ O-Ph	メル		-(CH ₂) ₄ -
C24	3-F-Ph	メル	エチル	エチル
C25	3-F-Ph	メル	1-フロピル	1-フロピル
C26	3-F-Ph	メル	メル	エチル
C27	3-F-Ph	メル	2-フロピル	2-フロピル
C28	3-F-Ph	メル	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
C29	3-F-Ph	メル		-(CH ₂) ₃ -
C30	3-F-Ph	メル		-(CH ₂) ₄ -
C31	Ph	エチル	エチル	エチル
C32	Ph	エチル	1-フロピル	1-フロピル
C33	Ph	エチル	メル	エチル
C34	Ph	エチル	2-フロピル	2-フロピル
C35	Ph	エチル	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
C36	Ph	エチル		-(CH ₂) ₃ -
C37	Ph	エチル		-(CH ₂) ₄ -
C38	3-F-Ph	エチル	エチル	エチル
C39	3-F-Ph	エチル	1-フロピル	1-フロピル
C40	3-F-Ph	エチル	メル	エチル
C41	3-F-Ph	エチル	2-フロピル	2-フロピル
C42	3-F-Ph	エチル	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
C43	3-F-Ph	エチル		-(CH ₂) ₃ -
C44	3-F-Ph	エチル		-(CH ₂) ₄ -
C45	Ph	ベンジル	エチル	エチル
C46	3-CH ₃ C(O)O-	n-フロピル	エチル	エチル

より成る群から他に従属的に選択される、
を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 1】 有効な鎮痛薬である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 2】 有効な免疫抑制剤、抗炎症剤、精神病の治療のための作用物質、薬物およびアルコール濫用のための医薬、胃炎および下痢を治療するための作用物質、心血管系作用物質、ならびに呼吸器疾患の治療のための作用物質である、請求項 1 記載の化合物。

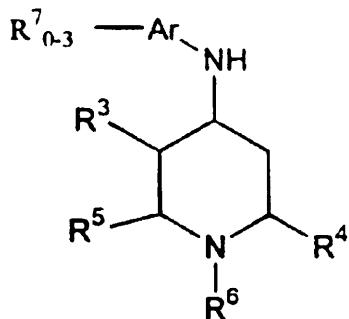
【請求項 1 3】 哺乳動物における痛みの治療用医薬の製造のための請求項 1 記載の化合物の使用。

【請求項 1 4】 免疫抑制剤、抗炎症剤、精神病の治療のための作用物質、薬物およびアルコール濫用のための医薬、胃炎および下痢を治療するための作用物質、心血管系作用物質、もしくは呼吸器疾患の治療のための作用物質を提供するための請求項 1 記載の化

合物使用。

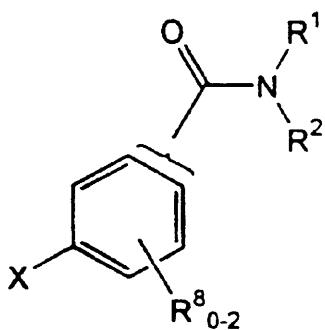
【請求項 15】 式：

【化4】



の化合物を、パラジウム触媒、ホスフィン配位子および塩基の存在下で、式：

【化5】



上式中、

Arは、それぞれ1ないし3個のR⁷で場合によっては置換されるフェニル、1-ナフチルもしくは2-ナフチルであり；

R¹およびR²は、水素、C₁₋₈アルキル；ハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシもしくはトリフルオロメチルで場合によっては一、二もしくは三置換されるフェニル；またはハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシもしくはトリフルオロメチルで場合によっては一、二もしくは三置換されるベンジルより成る群から独立に選択されるか、あるいは代わりに、R¹およびR²はそれらの結合するNと一緒にになって、ピロリジニル、モルホリニル、ピペリジニルおよびヘキサメチレンイミニルより成る群から選択される環を形成し、各前記環は1ないし4個のメチル基で場合によっては置換されていてもよく；

R³、R⁴およびR⁵は水素およびC₁₋₄アルキルから独立に選択され；

R⁶は、水素；C₁₋₈アルキル；C₃₋₆シクロアルキル；C₁₋₃アルキル、C₃₋₆アルケニル；C₁₋₆アルコキシ；C₁₋₃アルキル；4-C₁₋₄アルキル-4,5-ジヒドロ-5-オキソ-1H-トレトラゾル-1-イル；C₁₋₄アルキル；チエン-2-イル；C₁₋₄アルキル；チエン-3-イル；C₁₋₄アルキル；フラン-2-イル；C₁₋₄アルキル；フラン-3-イル；C₁₋₄アルキル；ピロル-2-イル；C₁₋₄アルキル；ピロル-3-イル；C₁₋₄アルキル；ピリジン-2-イル；C₁₋₄アルキル；ピリジン-3-イル；C₁₋₄アルキル；ピリジン-4-イル；C₁₋₄アルキル；ピラジニル；C₁₋₄アルキル；ピリミジン-2-イル；C₁₋₄アルキル；ピリミジン-4-イル；C₁₋₄アルキル；ピリミジン-5-イル；C₁₋₄アルキル；チアゾル-2-イル；C₁₋₄アルキル；チアゾル-4-イル；C₁₋₄アルキル；オキサゾル-2-イル；C₁₋₄アルキル；オキサゾル-4-イル；C₁₋₄アルキル；オキサゾル-5-イル；C₁₋₄アルキルおよびフェニル；C₁₋₄アルキルより成る群から選択され、ここで前述のチエニル、フラニル、ピロリル、チアゾリルおよびオキ

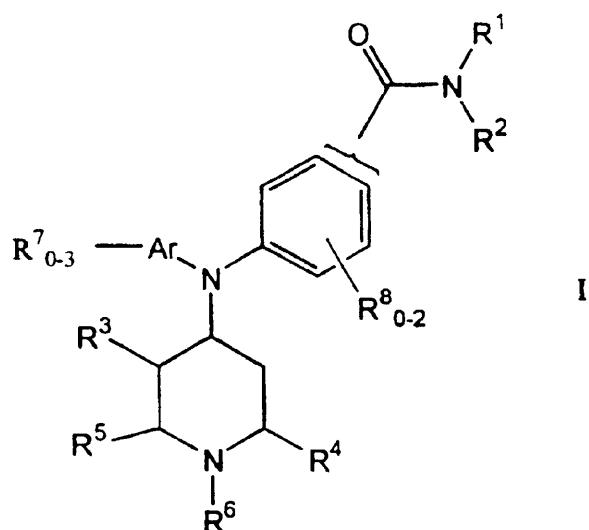
サゾリルは非縮合の R⁷ で場合によっては一、二もしくは三置換され、また、前述のピリジニル、ピラジニル、ピリミジニルおよびフェニルは R⁷ で場合によつては一、二もしくは三置換され；

R⁷ は、ヒドロキシ、ハロ、C₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルコキシ、C₁₋₃アシリル、C₁₋₃アシリルオキシ、シアノ、アミノ、C₁₋₃アシリルアミノ、C₁₋₃アルキルアミノ、ジ(C₁₋₃アルキル)アミノ、C₁₋₃アルキルチオ、C₁₋₃アルキルスルホニル、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシより成る群から独立に選択され、また、2個の R⁷ は、Ar の隣接する炭素原子に結合された - (CH₂)₃₋₅ - および - O (CH₂)₁₋₃ O - より成る群から選択される单一の部分を一緒に形成することができ；そして

R⁸ は、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシおよびトリフルオロメチルより成る群から独立に選択される。

の化合物を用いてアリール化する段階を含んで成る、式：

【化6】



の化合物の製造方法。