

【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21年6月25日(2009.6.25)

【公表番号】特表2008-540520(P2008-540520A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-511081(P2008-511081)

【国際特許分類】

C 07 C 65/40 (2006.01)
C 07 C 65/03 (2006.01)
C 07 C 65/105 (2006.01)
C 07 C 229/64 (2006.01)
C 07 C 323/62 (2006.01)
C 07 C 317/46 (2006.01)
C 07 C 65/24 (2006.01)
A 61 K 31/192 (2006.01)
C 07 D 271/06 (2006.01)
A 61 K 31/4245 (2006.01)
C 07 D 277/26 (2006.01)
A 61 K 31/426 (2006.01)
C 07 D 213/70 (2006.01)
A 61 K 31/4409 (2006.01)
C 07 D 277/64 (2006.01)
A 61 K 31/428 (2006.01)
C 07 D 309/04 (2006.01)
A 61 K 31/351 (2006.01)
C 07 D 213/32 (2006.01)
C 07 D 213/34 (2006.01)
A 61 K 31/4402 (2006.01)
C 07 D 311/04 (2006.01)
A 61 K 31/352 (2006.01)
C 07 D 333/60 (2006.01)
A 61 K 31/381 (2006.01)
C 07 D 295/14 (2006.01)
A 61 K 31/5375 (2006.01)
A 61 K 31/275 (2006.01)
C 07 D 217/20 (2006.01)
A 61 K 31/472 (2006.01)
C 07 D 215/14 (2006.01)
A 61 K 31/47 (2006.01)
C 07 D 217/16 (2006.01)
A 61 P 25/04 (2006.01)
A 61 P 25/06 (2006.01)
A 61 P 19/06 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 25/18 (2006.01)
A 61 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 65/40 C S P

C 0 7 C 65/03 D

C 0 7 C 65/105

C 0 7 C 229/64

C 0 7 C 323/62

C 0 7 C 317/46

C 0 7 C 65/24

A 6 1 K 31/192

C 0 7 D 271/06

A 6 1 K 31/4245

C 0 7 D 277/26

A 6 1 K 31/426

C 0 7 D 213/70

A 6 1 K 31/4409

C 0 7 D 277/64

A 6 1 K 31/428

C 0 7 D 309/04

A 6 1 K 31/351

C 0 7 D 213/32

C 0 7 D 213/34

A 6 1 K 31/4402

C 0 7 D 311/04

A 6 1 K 31/352

C 0 7 D 333/60

A 6 1 K 31/381

C 0 7 D 295/14

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/275

C 0 7 D 217/20

A 6 1 K 31/472

C 0 7 D 215/14

A 6 1 K 31/47

C 0 7 D 217/16

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月30日(2009.4.30)

【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

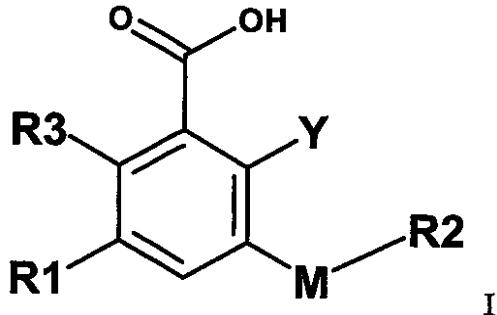
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

式中、

Yは水素、-OH、ハロ、-OC₁₋₆アルキル及び-C₁₋₆アルキルから選択され、最後の2つはハロ、-CN、-OH、-CF₃、-NH₂で場合により置換され；

R1は場合によりハロ、-CN、-OH、-CF₃、-OCF₃、-NH₂、-CONH₂で置換された、-C₃₋₆シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール及び-C₃₋₆-アルキルから選択され；

Mは-C(O)-、-C(H₂)-、-CH(OR^a)-、-N(OH)-、-N(R^a)-、-S(O)_r-、ヘテロアリール及び結合から選択され；ここでR^aは水素又はC₁₋₆アルキルであり、そしてrは0、1又は2であり；

R2は水素、ハロ、-CNから選択されるか、又は-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、-N(CH₃)₂、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール及び複素環式基から選択されるD基であり；

ここで、Dは、ハロ、-NO₂、-CN、-OH、-CF₃、-OCF₃、-NH₂、-CONH₂、-COOH、アリール、ヘテロアリール、複素環式基、-C₁₋₆アルキル、-C₁₋₆アルコキシ、ヘテロシクロアルキル及びC₁₋₆アルキルカルボキシレートから選択される1又はそれ以上の置換基Gで場合により置換され；

ここで、場合によりDは-C(O)-、-S-及び-S(O₂)-から選択されるリンカーベースLによりGに結合してもよく；

そして、Gは、置換可能である場合、ハロ、-NO₂、-CN、-OH、-CH₃、-OCH₃、-CF₃、-OCF₃、-NH₂、-CONH₂、-COOH及びC₁₋₆アルキルカルボキシレートから選択される1又はそれ以上の置換基で場合によりさらに置換され；そして

R3は-OH及びC₁₋₆アルコキシから選択されるが；

ただし、Mが結合であって、そしてR3が-OHである場合、R2は-C₁₋₆アルキルではなく

、

そしてMが-C(O)-である場合、R2は水素又は-CH₃ではなく、

そして、以下の化合物：

2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-6-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)スルフィニル]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-6-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、

2 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピル - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
2 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 5 - [(4 - メチルフェニル)スルホニル]安息香酸、
2 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルフィニル]安息香酸、
2 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、
2 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - [(4 - プロモ - 3 - メチルフェニル)スルホニル] - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - [(4 - プロモフェニル)スルホニル] - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - [(4 - プロモフェニル)チオ] - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - [(4 - クロロフェニル)スルホニル] - 6 - ヒドロキシ - 5 - イソプロピル - 2 - メチル安息香酸、
3 - プロモ - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(4 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (フェニルスルホニル)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (フェニルチオ)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)スルフィニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2 - ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - メチルフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - メチルフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルフィニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - クロロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)スルフィニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(2,5 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(2,5 - ジクロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル)スルフィニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(3,4 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(3,4 - ジクロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 3 - ニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 3 - ニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、

5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、

5 - [(4 - プロモフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、

5 - [(4 - クロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、

5 - [(4 - クロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸又は

3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - ヨード - 6 - メチル安息香酸
ではない。

【請求項 2】

Yが水素、 - OH、 - CH₃及び - OCH₃から選択され；

R1がフェニル、ピリジル、 - C₃₋₄-アルキル及びシクロヘキシルから選択され；

Mが - C(O) - 、 - C(H₂) - 、 - CH(OC₂H₅) - 、 - S(O)₂ - 、 - S - 、 - N(OH) - 、 - N(H) - 、 - N(CH₃) - 、オキサジアゾリル及び結合から選択され；

R2が水素、ハロ及び - CNから選択され；

Dがフェニル、シクロヘキシル、ピリジニル、ベンジル、チアゾリル、ナフチル、 - N(CH₃)₂、キノキサリニル、 - CN、オキシピリジニル、 - CH₃、t - ブチル、プロピル、チオフェニル及びジオキシド - ベンゾチエニルから選択され；

Gが - NH₂、 - CONH₂、 - Br、 - Cl、 - CN、 - F、 - OH、 - I、 - OCH₃、 - NO₂、t - ブチル、 - COOH、 - COOCH₃、 - OCF₃、イソプロピル、フェニル、 - CH₃、 - C₂H₅、モルホリニル、ピリジニル、ベンゾチアゾリル及び - CF₃から選択され；そして

R3が - OH又は - OCH₃である、

請求項 1に記載の化合物。

【請求項 3】

以下の化合物：

3 - tert - ブチル - 5 - (4 - クロロ - 3 - ヨードベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - tert - ブチル - ベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 安息香酸、
3 - ベンゾイル - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - クロロ - 2 - フルオロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - クロロ - 3 - フルオロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2,6 - ジヒドロキシ - 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - クロロ - ベンゾイル) - 2,6 - ジヒドロキシ - 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (3,4 - ジフルオロ - ベンゾイル) - 2,6 - ジヒドロキシ - 安息香酸
、
3 - tert - ブチル - 2,6 - ジヒドロキシ - 5 - (キノキサリン - 2 - イルカルボニル) 安息香酸、
3 - (4 - クロロ - ベンゾイル) - 5 - シクロヘキシリル - 2,6 - ジヒドロキシ - 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - フェニル) - ヒドロキシイミノ - メチル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 安息香酸、
5,5' - ジ - tert - ブチル - 4,4' - ジヒドロキシ - 3' - (メトキシカルボニル) - 2,2' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - フルオロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸
、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (4 - メチルベンゾイル) 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (3,4 - ジクロロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [4 - (トリフルオロメチル)ベンゾイル] 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (2,4 - ジクロロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [3 - (トリフルオロメトキシ)ベンゾイル] 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - (3 - イソプロピルベンゾイル) - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (3 - ニトロベンゾイル) 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - ヒドロキシベンゾイル) - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [2 - (トリフルオロメチル)ベンゾイル] 安息香酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2,2' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 4' - メトキシ - 2,2' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2,2' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 4' - メトキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 3' - イソプロピル - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
3',5 - ジ - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2,5' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボン酸

3 - アニリノ - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)(メチル)アミノ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [5 - (4 - クロロフェニル) - [1,2,4]オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(4 - メトキシフェニル)チオ] - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチルチオ)安息香酸、
3 - [(2,4 - ジクロロフェニル)チオ] - 6 - ヒドロキシ - 5 - イソプロピル - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジクロロフェニル)チオ] - 2,6 - ジヒドロキシ安息香酸、
2 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピル - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチルチオ)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - フェニル - 1,3 - チアゾール - 2 - イル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2,6 - ジヒドロキシ - 5 - (1 - ナフチルチオ)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジクロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - (ベンジルチオ) - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,3 - ジフルオロベンジル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロベンジル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - (ベンジルスルフィニル) - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - (ベンジルスルホニル) - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(4 - メトキシフェニル)スルホニル] - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチルスルホニル)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2,6 - ジヒドロキシ安息香酸、
3 - [(2,4 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 6 - ヒドロキシ - 5 - イソプロピル - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)(エトキシ)メチル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3,5 - ジ - tert - ブチル - 2,6 - ジメトキシ安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,3 - ジフルオロベンジル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (ピリジン - 4 - イルチオ)安息香酸、
2 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピル - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチルスルホニル)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - {[5 - フルオロ - 1,3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル)メチル]チオ} - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(3 - メトキシベンジル)チオ] - 6 - メチル安息香酸、

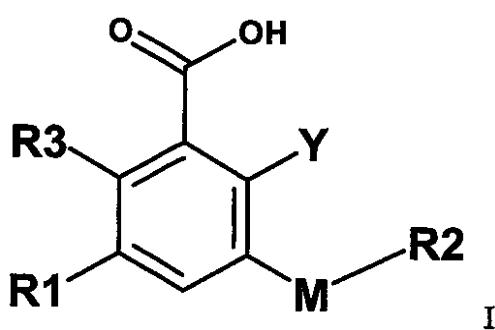
3 - tert - プチル - 5 - [(2 - シアノベンジル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イルメチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(ピリジン - 3 - イルメチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(ピリジン - 4 - イルメチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - (イソブチルチオ) - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2 - フェニルエチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - {[2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]チオ} - 安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(2,3 - ジフルオロベンジル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(4 - クロロベンジル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(ピリジン - 2 - イルメチル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - メチルベンジル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - メチルベンジル)チオ]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - {[2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]スルホニル} - 安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (フェニルアセチル)安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [フェニル(フェニルチオ)アセチル]安息香酸、
3,5 - ジ - tert - プチル - 2 - クロロ - 6 - ヒドロキシ安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(3,4 - ジフルオロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(3,4 - ジフルオロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - プチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - {[4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]スルホニル} 安息香酸、
3 - {[3,5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]スルホニル} - 5 - tert - プチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(2,6 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(2,3 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - プチル - 5 - [(3,5 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3' - tert - プチル - 4 - ヒドロキシ - 5' - メチル - 5 - ピリジン - 3 - イルビフェニル - 3

- カルボン酸、
 3 - (1 - ベンゾフラン - 2 - イル) - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
 3 - tert - ブチル - 5 - (1,1 - ジオキシド - 1 - ベンゾチエン - 2 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
 5 - tert - ブチル - 3',4' - ジクロロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
 5 - tert - ブチル - 2',4' - ジクロロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
 5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4' - モルホリン - 4 - イルビフェニル - 3 - カルボン酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチル) 安息香酸、
 5 - tert - ブチル - 3' - シアノ - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸
 、
 5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3',5' - ビス(トリフルオロメチル)ビフェニル - 3 - カルボン酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (2 - ナフチル) 安息香酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - イソキノリン - 4 - イル - 6 - メチル安息香酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 3 - イル安息香酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 8 - イル安息香酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 6 - イル安息香酸、
 3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 5 - イル安息香酸、
 4' - ヒドロキシ - 6' - メトキシ - 1,1':3',1''' - テルフェニル - 5' - カルボン酸、
 4,4''' - ジフルオロ - 4' - ヒドロキシ - 1,1':3',1''' - テルフェニル - 5' - カルボン酸
 、
 3 - tert - ブチル - 4' - ヒドロキシ - 5 - メチル - 1,1':3',1''' - テルフェニル - 5' - カルボン酸、及び
 2,6 - ジヒドロキシ - 3,5 - ジイソプロピル安息香酸
 からなる群より選択される化合物。

【請求項 4】

治療において使用するための、式 I :

【化 2】



の化合物、又は医薬として許容し得るその塩。

式中、

Yは水素、-OH、ハロ、-OC₁₋₆アルキル及び-C₁₋₆アルキルから選択され、最後の2つはハロ、-CN、-OH、-CF₃、-NH₂で場合により置換され；

R1は場合によりハロ、-CN、-OH、-CF₃、-OCF₃、-NH₂、-CONH₂で置換された、-C₃₋₆シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール及び-C₃₋₆アルキルから選択され；

Mは-C(O)-、-C(H₂)-、-CH(OR^a)-、-N(OH)-、-N(R^a)-、-S(O)_r-、ヘテロアリール及び結合から選択され；ここでR^aは水素又はC₁₋₆アルキルであり、そしてrは0

、1又は2であり；

R2は水素、ハロ、-CNから選択されるか、又は-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、-N(CH₃)₂、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール及び複素環式基から選択されるD基であり、

ここで、Dは、ハロ、-NO₂、-CN、-OH、-CF₃、-OCF₃、-NH₂、-CONH₂、-COOH、アリール、ヘテロアリール、複素環式基、-C₁₋₆アルキル、-C₁₋₆アルコキシ、ヘテロシクロアルキル及びC₁₋₆アルキルカルボキシレートから選択される1又はそれ以上の置換基Gで場合により置換され；

ここで、場合によりDは-C(O)-、-S-及び-S(O₂)-から選択されるリンカーベースLによりGに結合してもよく；

そしてGは、置換可能である場合、ハロ、-NO₂、-CN、-OH、-CH₃、-OCH₃、-CF₃、-OCF₃、-NH₂、-CONH₂、-COOH及びC₁₋₆アルキルカルボキシレートから選択される1又はそれ以上の置換基で場合によりさらに置換され；そして

R3は-OH及びC₁₋₆アルコキシから選択されるが；

ただし、Mが結合であってそしてR3が-OHである場合、R2は-C₁₋₆アルキルではない。

【請求項5】

Yが水素、-OH、-CH₃及び-OCH₃から選択され；

R1がアリール、ヘテロアリール、-C₃₋₄-アルキル及びシクロヘキシルから選択され；

Mが-C(O)-、-C(H₂)-、-CH(OC₂H₅)-、-S(O)₂-、-S-、-N(OH)-、-N(H)-、-N(CH₃)-、オキサジアゾリル及び結合から選択され；

R2がフェニル、シクロヘキシル、ピリジニル、ベンジル、プロモ、チアゾリル、ナフチル、キノキサリニル、オキシピリジニル、プロピル、チオフェニル及びジオキシド-ベンゾチエニルから選択され；

Gが-NH₂、-CONH₂、-Br、-Cl、-CN、-F、-OH、-I、-OCH₃、-NO₂、t-ブチル、-COOH、-COOCH₃、-OCF₃、イソプロピル、フェニル、-CH₃、-C₂H₅、モルホリニル、ピリジニル、ベンゾチアゾリル及び-CF₃から選択され；そして、

R3が-OH又は-OCH₃である、

請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

治療において使用するための、以下の化合物：

2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-6-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)スルフィニル]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-6-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-6-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)チオ]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-メチル-5-[(4-メチルフェニル)スルホニル]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)スルフィニル]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、

2-ヒドロキシ-3-メチル-5-[(4-ニトロフェニル)チオ]安息香酸、

3-[(4-プロモ-3-メチルフェニル)スルホニル]-5-tert-ブチル-6-ヒドロキシ-2-メチル安息香酸、

3-[(4-プロモ-3-メチルフェニル)チオ]-5-tert-ブチル-6-ヒドロキシ-2-メチル安息香酸、

3-[(4-プロモフェニル)スルホニル]-5-tert-ブチル-6-ヒドロキシ-2-メチル安息香酸、

3-[(4-クロロフェニル)スルホニル]-6-ヒドロキシ-5-イソプロピル-2-メチル安息香酸、

3 - プロモ - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(4 - ニトロフェニル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (フェニルスルホニル)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (フェニルチオ)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)スル
フィニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)スル
ホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)チオ]
]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2 - ニトロフェニル)スルホニル]
安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2 - ニトロフェニル)チオ]安息香
酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - ニトロフェニル)スルホニル]
安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - ニトロフェニル)チオ]安息香
酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - メチルフェニル)スルホニル]
安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - メチルフェニル)チオ]安息香
酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルフィニル]
]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)スルホニル]
安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(4 - ニトロフェニル)チオ]安息香
酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (4 - クロロベンゾイル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)スルフィニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 -
メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メ
チル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安
息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,5 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メ
チル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,5 - ジクロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安
息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル)スルフィニル] - 2 - ヒドロキ
シ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキ
シ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メ
チル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(3,4 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メ
チル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(3,4 - ジクロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安
息香酸、

3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 3 - ニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロ - 3 - ニトロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
5 - [(2,4 - ジニトロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、
5 - [(4 - プロモフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、
5 - [(4 - クロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、
5 - [(4 - クロロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 3 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - ヨード - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,3 - ジフルオロベンジル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (ピリジン - 4 - イルチオ)安息香酸、
、
2 - ヒドロキシ - 3 - イソプロピル - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチルスルホニル)安息香酸、
、
3 - tert - ブチル - 5 - {[(5 - フルオロ - 1,3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル)メチル]チオ} - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - [(3 - メトキシベンジル)チオ] - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - シアノベンジル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イルメチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(ピリジン - 3 - イルメチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(ピリジン - 4 - イルメチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - (イソブチルチオ) - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2 - フェニルエチル)チオ]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - {[2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]チオ} - 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,3 - ジフルオロベンジル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(4 - クロロベンジル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(ピリジン - 2 - イルメチル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - メチルベンジル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(3 - メチルベンジル)チオ]安息香酸、

3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - { [2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]スルホニル } - 安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (フェニルアセチル)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [フェニル(フェニルチオ)アセチル]安息香酸、
3,5 - ジ - tert - ブチル - 2 - クロロ - 6 - ヒドロキシ安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(3,4 - ジフルオロフェニル)チオ] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(3,4 - ジフルオロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - [(2,4,5 - トリクロロフェニル)スルホニル]安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - { [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]スルホニル } 安息香酸、
3 - { [3,5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]スルホニル } - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,6 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2,3 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - [(3,5 - ジクロロフェニル)スルホニル] - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
3' - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 5' - メチル - 5 - ピリジン - 3 - イルビフェニル - 3 - カルボン酸、
3 - (1 - ベンゾフラン - 2 - イル) - 5 - tert - ブチル - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 5 - (1,1 - ジオキシド - 1 - ベンゾチエン - 2 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル安息香酸、
5 - tert - ブチル - 3',4' - ジクロロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 2',4' - ジクロロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4' - モルホリン - 4 - イルビフェニル - 3 - カルボン酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (1 - ナフチル)安息香酸、
5 - tert - ブチル - 3' - シアノ - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルビフェニル - 3 - カルボン酸、
5 - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3',5' - ビス(トリフルオロメチル)ビフェニル - 3 - カルボン酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - (2 - ナフチル)安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 5 - イソキノリン - 4 - イル - 6 - メチル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 3 - イル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 8 - イル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 6 - イル安息香酸、
3 - tert - ブチル - 2 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 5 - キノリン - 5 - イル安息香酸、
4' - ヒドロキシ - 6' - メトキシ - 1,1' : 3',1''' - テルフェニル - 5' - カルボン酸、

4,4'' - ジフルオロ - 4' - ヒドロキシ - 1,1' : 3',1''' - テルフェニル - 5' - カルボン酸

、
3 - tert - ブチル - 4' - ヒドロキシ - 5 - メチル - 1,1' : 3',1''' - テルフェニル - 5' - カルボン酸、及び

2,6 - ジヒドロキシ - 3,5 - ジイソプロピル安息香酸
からなる群より選択される化合物。

【請求項 7】

痛みを伴う糖尿病性神経障害、外傷後神経痛、ヘルペス後神経痛、三叉神経痛、関節炎、リウマチ様疾患、線維筋痛、神経根障害を伴う腰痛及び術後疼痛のような神経因性又は炎症性疼痛症候群；アンギナ、腎症痛又は胆石症痛、月経、偏頭痛及び痛風、卒中、頭部外傷、酸素欠乏障害及び虚血性傷害、低血糖、心血管疾患及び／又はがんと関係がある疼痛；耳鳴のような聽神経障害；網膜症、糖尿病性網膜症又は緑内障のような眼科的障害；アルコール症、薬物嗜癖及び精神病のような精神疾患；関節リウマチ及び変形性関節症のような炎症関連疾患；並びに／又は関節硬化及び発作の治療において使用するための、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

活性成分として治療有効量の請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の化合物を、1 又はそれ以上の医薬として許容し得る、希釈剤、添加剤及び／又は不活性担体と共に含有する医薬組成物。

【請求項 9】

痛みを伴う糖尿病性神経障害、外傷後神経痛、ヘルペス後神経痛、三叉神経痛、関節炎、リウマチ様疾患、線維筋痛、神経根障害を伴う腰痛及び術後疼痛のような神経因性又は炎症性疼痛症候群；アンギナ、腎症痛又は胆石症痛、月経、偏頭痛及び痛風、卒中、頭部外傷、酸素欠乏障害及び虚血性傷害、低血糖、心血管疾患及び／又はがんと関係がある疼痛；耳鳴のような聽神経障害；網膜症、糖尿病性網膜症又は緑内障のような眼科的障害；アルコール症、薬物嗜癖及び精神病のような精神疾患；関節リウマチ及び変形性関節症のような炎症関連疾患；並びに／又は関節硬化及び発作の治療において使用するための、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

痛みを伴う糖尿病性神経障害、外傷後神経痛、ヘルペス後神経痛、三叉神経痛、関節炎、リウマチ様疾患、線維筋痛、神経根障害を伴う腰痛及び術後疼痛のような神経因性又は炎症性疼痛症候群；アンギナ、腎症痛又は胆石症痛、月経、偏頭痛及び痛風、卒中、頭部外傷、酸素欠乏障害及び虚血性傷害、低血糖、心血管疾患及び／又はがんと関係がある疼痛；耳鳴のような聽神経障害；網膜症、糖尿病性網膜症又は緑内障のような眼科的障害；アルコール症、薬物嗜癖及び精神病のような精神疾患；関節リウマチ及び変形性関節症のような炎症関連疾患；並びに／又は関節硬化及び発作の治療用医薬の製造における、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 11】

神経因性疼痛症候群の治療用医薬の製造における、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

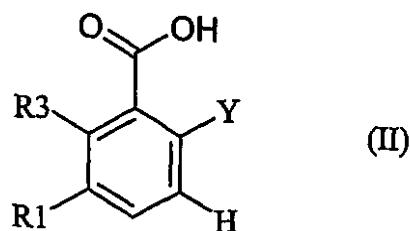
【請求項 12】

治療の必要なヒトを含む哺乳動物に、治療有効量の請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、痛みを伴う糖尿病性神経障害、外傷後神経痛、ヘルペス後神経痛、三叉神経痛、関節炎、リウマチ様疾患、線維筋痛、神経根障害を伴う腰痛及び術後疼痛のような神経因性又は炎症性疼痛症候群；アンギナ、腎症痛又は胆石症痛、月経、偏頭痛及び痛風、卒中、頭部外傷、酸素欠乏障害及び虚血性傷害、低血糖、心血管疾患及び／又はがんと関係がある疼痛；耳鳴のような聽神経障害；網膜症、糖尿病性網膜症又は緑内障のような眼科的障害；アルコール症、薬物嗜癖及び精神病のような精神疾患；関節リウマチ及び変形性関節症のような炎症関連疾患；並びに／又は関節硬化及び発作の治療方法。

【請求項 1 3】

a) 場合により保護された式(II)

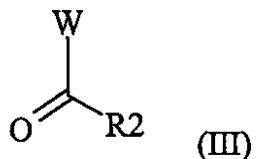
【化 3】



の化合物を、

i) 適切な溶媒中で、式(III)

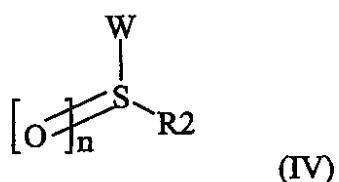
【化 4】



の化合物（式中、Wはハロゲン又は適切な脱離基である）と反応させるか、又は

ii) 適切な溶媒中で、式(IV)

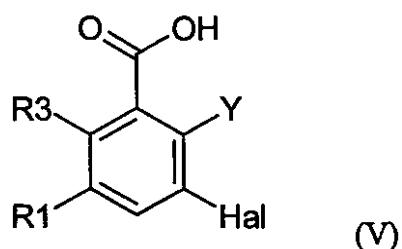
【化 5】



の化合物（式中、Wはハロゲンであり、そしてnは0、1又は2である）と反応させ、場合により次いで、nが0又は1である場合は酸化剤で処理し、又は

b) 場合により保護された式(V)

【化 6】



の化合物（式中、Halはハロゲン又はスルホニルオキシ基である）を、

i) 一酸化炭素又は乾燥窒素雰囲気下で、そして金属触媒の存在下で、式(VI)

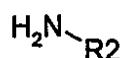
【化 7】



(VI)

の有機金属試薬（式中、Metは適切な金属基である）又は有機ホウ素試薬と反応させるか、又は

iii) 金属触媒の存在下で、そして適切な不活性溶媒又は希釀剤の存在下で、式(VII)
【化8】

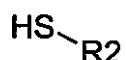


(VII)

のアミンと反応させるか、又は

iii) 式(X)

【化9】

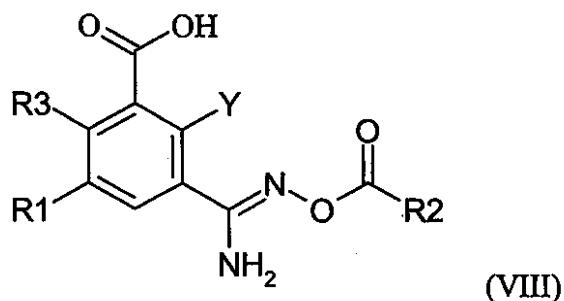


(X)

のメルカプタンと反応させるか、又は

c) 場合により保護された式(VIII)

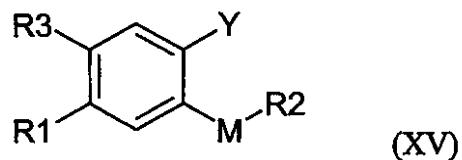
【化10】



の化合物を、適切な溶媒中、30 ~ 還流温度で加熱することにより反応させるか、又は

d) 場合により保護された式(XV)

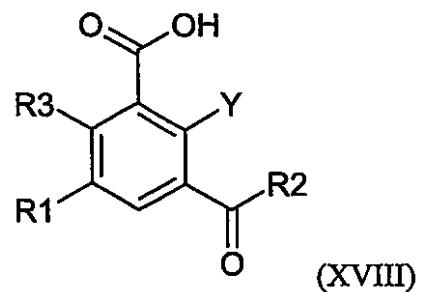
【化11】



の化合物を、適切な溶媒中、-78 ~ 還流温度で、適切な塩基及び二酸化炭素と反応させるか、又は

j) 場合により保護された式(XVIII)

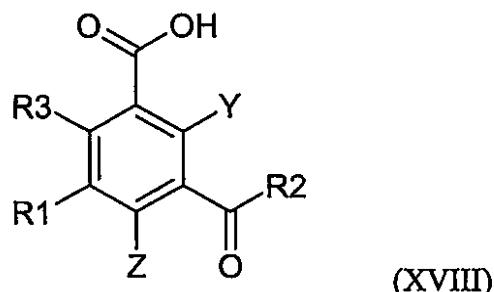
【化12】



の化合物を、適切な溶媒中、適切な還元剤と反応させるか、又は適切な触媒上で接触水素化することにより反応させるか、又は

k) 場合により保護された式(XVIII)

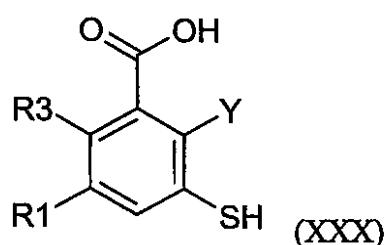
【化13】



の化合物を、溶媒中塩基の存在下で、水を除去しながら還流温度で、場合により置換されたヒドロキシルアミン塩酸塩と反応させるか、又は

1) 場合により保護された式(XXX)

【化14】



の化合物を、適切な溶媒中の適切な塩基の存在下で、0 ~ 還流温度で、適切な求電子物質と反応させ、

そして、その後、場合により、

i) 式Iの化合物を、式Iの別の化合物に変換し；そして／又は、

ii) 保護基を除去し；そして／又は

iii) 医薬として許容し得る塩を形成すること；

を含む、Y、R1、R2及びR3が、特に明記しない限り、式Iにおいて定義されたとおりである式Iの化合物の製造方法。