

【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4月20日(2006.4.20)

【公表番号】特表2006-502963(P2006-502963A)

【公表日】平成18年1月26日(2006.1.26)

【年通号数】公開・登録公報2006-004

【出願番号】特願2003-564026(P2003-564026)

【国際特許分類】

C 0 7 D 307/64 (2006.01)
A 6 1 K 31/365 (2006.01)
A 6 1 K 31/385 (2006.01)
A 6 1 K 31/401 (2006.01)
A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
A 6 1 K 31/41 (2006.01)
A 6 1 K 31/4184 (2006.01)
A 6 1 K 31/4196 (2006.01)
A 6 1 K 31/423 (2006.01)
A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
A 6 1 K 31/428 (2006.01)
A 6 1 K 31/433 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)
A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/04 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 21/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/14 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/18 (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 37/00 (2006.01)
A 6 1 P 41/00 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 307/68 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 495/04 (2006.01)
C 0 7 K 5/037 (2006.01)
A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 307/64	C S P
A 6 1 K 31/365	
A 6 1 K 31/385	
A 6 1 K 31/401	
A 6 1 K 31/4025	
A 6 1 K 31/41	
A 6 1 K 31/4184	
A 6 1 K 31/4196	
A 6 1 K 31/423	
A 6 1 K 31/4245	
A 6 1 K 31/428	
A 6 1 K 31/433	
A 6 1 K 31/444	
A 6 1 K 31/4709	
A 6 1 K 31/506	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 9/04	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 13/12	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 21/00	
A 6 1 P 21/02	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 25/00	1 0 1
A 6 1 P 25/02	
A 6 1 P 25/14	
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 37/00	
A 6 1 P 41/00	
A 6 1 P 43/00	1 0 5
C 0 7 D 307/68	
C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 417/12	
C 0 7 D 417/14	
C 0 7 D 495/04	1 1 6

C 0 7 K 5/037

A 6 1 K 37/02

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月6日(2006.3.6)

【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

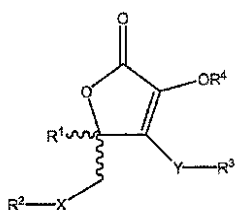
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



式I

の化合物(単一の互変異性体、単一の立体異性体ならびに互変異性体および/または立体異性体の混合物を含む)、ならびにそれらの薬学的に受容可能な塩であって、

R^1 は: $-C(O)OR'$; $-C(O)NR'R''$; $-CH_2OR'''$; シアノ; 必要に応じて置換されたヘテロシクリル; 必要に応じて置換されたヘテロシクリル-アルキル; 必要に応じて置換されたヘテロアリール、または必要に応じて置換されたヘテロアルキルであり;

R^2 は: 必要に応じて置換されたアルキル; 必要に応じて置換されたシクロアルキル; 必要に応じて置換されたアリール; 必要に応じて置換されたアラルキル; 必要に応じて置換されたヘテロシクリル; 必要に応じて置換されたヘテロアリール; 必要に応じて置換されたヘテロアラルキル; 必要に応じて置換されたヌクレオシド; 必要に応じて置換されたアミノ酸; または必要に応じて置換されたジペプチド、トリペプチドもしくはテトラペプチドであり;

R^3 は: 必要に応じて置換されたアルキル; 必要に応じて置換されたシクロアルキル; 必要に応じて置換されたアリール; 必要に応じて置換されたアラルキル; 必要に応じて置換された複素ヘテロシクリル式; 必要に応じて置換されたヘテロアリール; 必要に応じて置換されたヘテロアラルキル; 必要に応じて置換されたヌクレオシド; 必要に応じて置換されたアミノ酸; または必要に応じて置換されたジペプチド、トリペプチドもしくはテトラペプチドであり;

R^4 は: 水素; アルキル; アルキルカルボニル; (ポリ)アルコキシアルキレン; またはジアルコキシホスホリルオキシであり;

X は: 低級アルキレン; $-N(R')$; $-S-$; $-S(O)-$; $-S(O)_2-$; または X は、 R^2 と一緒になって、 $-P(O)(OR')_2$ であり;

Y は: $-N(R')$; $-S-$; $-S(O)-$; $-S(O)_2-$; または Y は、 R^3 と一緒になって、 $-P(O)(OR')_2$ であり;

あるいは X- R^2 が Y- R^3 と一緒になって、必要に応じて置換された脂肪族環もしくは芳香族環を形成し;

R' は: 水素; アルケニル; 必要に応じて置換されたアルキル; 必要に応じて置換されたシクロアルキル; ホスホリル; または必要に応じて置換されたアリールであり;

R' は：水素；アルケニル；必要に応じて置換されたアルキル；または必要に応じて置換されたアリールであり；

あるいはR' およびR' ' が、これらが結合する原子と一緒にあって、5～7員の飽和または不飽和芳香族環を形成し、必要に応じて、N、O、またはSから選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子が組み込まれ、そして必要に応じて、必要に応じて置換された低級アルキル、ハロ、シアノ、アルキルチオ、低級アルコキシ、カルボキシ、ベンジル、およびオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基で置換され；

R' ' ' は：水素；アルケニル；必要に応じて置換されたアルキル；アシル、必要に応じて置換されたシクロアルキル；ホスホリル；または必要に応じて置換されたアリールであり；

ただし、該化合物は、4-ヒドロキシ-3-メタンスルホニル-2-メタン-スルホニルメチル-5-オキソ-2,5-ジヒドロフラン-2-カルボン酸エチルエステルではなく、さらにXが低級アルキレンである場合、R² は必要に応じて置換されたアルキルでない、化合物(単一の互変異性体、単一の立体異性体ならびに互変異性体および/または立体異性体の混合物を含む)、ならびにそれらの薬学的に受容可能な塩。

【請求項2】

XおよびYが、共に-S-、-S(O)-、および-S(O)₂-から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

XおよびYが、共に-S-である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R⁴ が水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R⁴ が水素である、請求項2に記載の化合物。

【請求項6】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、R¹ が-CH₂OR' ' '；-C(O)OR'；または-C(O)NR' R' 'であり；そしてR'、R' '、およびR' ' 'が水素および(C₁～C₈)アルキルから選択される、化合物。

【請求項7】

請求項2に記載の化合物であって、R¹ が-CH₂OR' ' '；-C(O)OR'；または-C(O)NR' R' 'であり；そしてR'、R' '、およびR' ' 'が水素および(C₁～C₈)アルキルから選択される、化合物。

【請求項8】

請求項5に記載の化合物であって、R¹ が-CH₂OR' ' '；-C(O)OR'；または-C(O)NR' R' 'であり；そしてR'、R' '、およびR' ' 'が水素および(C₁～C₈)アルキルから選択され；そしてR'が水素および(C₁～C₈)アルキルから選択される、化合物。

【請求項9】

請求項2に記載の化合物であって、R² およびR³ は同一であり、以下：必要に応じて置換されたアルキル；必要に応じて置換されたシクロアルキル；必要に応じて置換されたアリール；必要に応じて置換されたアラールキル；必要に応じて置換されたヘテロアリール；および必要に応じて置換されたヘテロアラールキルから選択される、化合物。

【請求項10】

請求項9に記載の化合物であって、R² およびR³ は同一であり、以下：必要に応じて置換された(C₁～C₈)アルキル；必要に応じて置換された(C₃～C₈)シクロアルキル；必要に応じて置換されたフェニル；必要に応じて置換されたナフタレニル；必要に応じて置換されたベンジル；必要に応じて置換された1-H-ベンゾイミダゾール-2-イル；必要に応じて置換されたベンゾチアゾール-2-イル；必要に応じて置換されたベンゾオキサゾール-2-イル；必要に応じて置換されたベンゾセレナゾール-2-イル；必要に応じて置換されたフラン-2-イル-低級アルキル；必要に応じて置換されたチアゾ

ール - 2 - イル；必要に応じて置換された 1 H - イミダゾール - 2 - イル；必要に応じて置換されたピリジン - 2 - イル；必要に応じて置換されたピリミジン - 2 - イル；必要に応じて置換されたキノリン - 4 - イル；必要に応じて置換された [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - イル；必要に応じて置換された 2 H - [1 , 2 , 4] - トリアゾール - 3 - イル；および必要に応じて置換された [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルから選択され；

そしてここで該置換基は、(C₁ ~ C₈) アルキル；(C₁ ~ C₈) アルケニル；ハロゲン；ハロアルキル；アシル、スルホン酸；スルファニル；アミノ；1 置換アミノまたは 2 置換アミノ；アリール；カルボキシ；カルボキシビニル；エステル；アミド、ヒドロキシ；およびアルコキシから選択される、化合物。

【請求項 1 1】

請求項 1 0 に記載の化合物であって、R² および R³ は同一であり、以下：1 - H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル；ベンゾチアゾール - 2 - イル；5 - メトキシ - ベンゾチアゾール - 2 - イル；6 - ニトロ - ベンゾチアゾール - 2 - イル；ベンゾオキサゾール - 2 - イル；4 - メトキシ - ベンジル；2 , 4 - ジクロロ - ベンジル；2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジル；5 - アミノ - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル；フラン - 2 - イルメチル；シクロヘキシル；ピリジン - 4 - イル；5 - フェニル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - イル；ピロリジン - 1 - カルボチオイル；4 - (2 - メトキシカルボニル - ビニル) - フェニル；4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル；4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル；およびピリミジン - 2 - イルから選択される、化合物。

【請求項 1 2】

X および Y が - S - である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

X および Y が - S - である、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 3 に記載の化合物であって、R¹ は - C (O) O R ' であり；R ' は水素および (C₁ ~ C₈) アルキルから選択され；そして R⁴ は水素である、化合物。

【請求項 1 5】

請求項 1 3 に記載の化合物であって、R¹ は - C H₂ O R ' ' ' であり；R ' ' ' は水素および (C₁ ~ C₈) アルキルから選択され；そして R⁴ は水素である、化合物。

【請求項 1 6】

請求項 1 3 に記載の化合物であって、R¹ は - C (O) N R ' R ' ' であり；R ' および R ' ' は水素、(C₁ ~ C₈) アルキルおよびヒドロキシ (C₁ ~ C₈) アルキルから選択され；そして R⁴ は水素である、化合物。

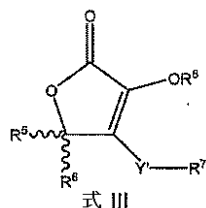
【請求項 1 7】

請求項 1 に記載の化合物であって、R² および R³ が、必要に応じて置換されたジチア - シクロヘキセン；必要に応じて置換されたジチア - シクロヘプテン；または 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - 5 , 9 - ジチア - ベンゾシクロヘプテンを形成し；そしてここで、該置換基が、(C₁ ~ C₈) アルキル、ハロゲン、またはオキソから選択される、化合物。

【請求項 1 8】

式 I I I :

【化 2】



の化合物 (単一の互変異性体、単一の立体異性体ならびに互変異性体および / または立体異性体の混合物を含む)、ならびにそれらの薬学的に受容可能な塩であって、

R^5 は： $-C(O)OR^a$; $-C(O)NR^aR^b$; $-CH_2OR^d$; $-C(O)R^c$; シアノ；必要に応じて置換されたヘテロシクリル；または必要に応じて置換されたヘテロアリアルであり；

R^6 は：水素； $-C(O)OR^a$; $-C(O)NR^aR^b$; $-CH_2OR^d$; $-C(O)R^c$; シアノ；必要に応じて置換されたアルキル；必要に応じて置換されたヘテロシクリル；必要に応じて置換されたアリアル、または必要に応じて置換されたヘテロアリアルであり；

あるいは R^5 および R^6 が、それらが結合する原子と一緒にあって、必要に応じて置換された環を形成し；

R^7 は：必要に応じて置換されたアルキル；必要に応じて置換されたシクロアルキル；必要に応じて置換されたアリアル；必要に応じて置換されたアラルキル；必要に応じて置換されたヘテロシクリル；必要に応じて置換されたヘテロアリアル；必要に応じて置換されたヘテロアラルキル；必要に応じて置換されたヌクレオシド；必要に応じて置換されたアミノ酸；または必要に応じて置換されたジペプチド、トリペプチドもしくはテトラペプチドであり；ただし、 R^6 がアルキルである場合、 R^7 は必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロアリアル、または必要に応じて置換されたヘテロアラルキルであり；

あるいは R^5 および R^7 が、それらが結合する原子と一緒にあって、必要に応じて置換された複素環式環を形成し；

R^8 は：水素；アルキル；アルキルカルボニル；(ポリ)アルコキシアルキレン；またはジアルコキシホスホリルオキシであり；

Y' は： $-N(R^a)-$; $S-$; $-S(O)-$; または $-S(O)_2-$ であり；

R^a は：水素；アルケニル；必要に応じて置換されたアルキル；必要に応じて置換されたシクロアルキル；または必要に応じて置換されたアリアルであり；

R^b は：水素；アルケニル；必要に応じて置換されたアルキル；または必要に応じて置換されたアリアルであり；

あるいは R^a および R^b が、それらが結合する原子と一緒にあって、5～7員の飽和または不飽和芳香族環を形成し、必要に応じて、N、O、またはSから選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を組み込み、そして必要に応じて、必要に応じて置換された低級アルキル、ハロ、シアノ、アルキルチオ、低級アルコキシ、カルボキシ、ベンジル、およびオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基で置換され；

R^c は、必要に応じて置換されたアルキルまたは必要に応じて置換されたアリアルであり；そして

R^d は：水素；アルケニル；必要に応じて置換されたアルキル；アシル、必要に応じて置換されたシクロアルキル；または必要に応じて置換されたアリアルである；

化合物(単一の互変異性体、単一の立体異性体ならびに互変異性体および/または立体異性体の混合物を含む)、ならびにそれらの薬学的に受容可能な塩。

【請求項19】

Y' が $-S-$; $-S(O)-$; および $-S(O)_2-$ から選択される、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

Y' が $-S-$ である、請求項18に記載の化合物。

【請求項21】

R^8 が水素である、請求項18に記載の化合物。

【請求項22】

R^8 が水素である、請求項20に記載の化合物。

【請求項23】

請求項20に記載の化合物であって、 R^5 が $-C(O)OR^a$ であり；そして R^a が水素； $(C_1 \sim C_8)$ アルキル；および $(C_1 \sim C_8)$ アルキル- $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキルから選択される、化合物。

【請求項 24】

請求項 20 に記載の化合物であって、 R^6 が水素または $-C(O)OR^a$ であり；そして R^a が水素および $(C_1 \sim C_8)$ アルキルから選択される、化合物。

【請求項 25】

請求項 23 に記載の化合物であって、 R^6 が水素または $-C(O)OR^a$ であり；そして R^a が水素および $(C_1 \sim C_8)$ アルキルから選択される、化合物。

【請求項 26】

請求項 20 に記載の化合物であって、 R^5 が $-C(O)R^c$ であり、そして R^c が水素； $(C_1 \sim C_8)$ アルキル；およびアリールから選択される、化合物。

【請求項 27】

R^6 が水素である、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

請求項 20 に記載の化合物であって、 R^7 がベンジル；4-フルオロベンジル；1-H-ベンゾイミダゾール-2-イル；5-メチル-1-H-ベンゾイミダゾール-2-イル；ベンゾチアゾール-2-イル；5-クロロ-ベンゾチアゾール-2-イル；および4-フェニル-チアゾール-2-イルから選択される、化合物。

【請求項 29】

請求項 28 に記載の化合物であって、 R^5 が $-C(O)OR^a$ であり； R^a が水素； $(C_1 \sim C_8)$ アルキル；および $(C_1 \sim C_8)$ アルキル- $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキルから選択され；そして R^6 が水素である、化合物。

【請求項 30】

請求項 28 に記載の化合物であって、 R^5 および R^6 が $-C(O)OR^a$ であり； R^a が水素および $(C_1 \sim C_8)$ アルキルから選択され；そして R^6 が水素である、化合物。

【請求項 31】

請求項 28 に記載の化合物であって、 R^5 が $-C(O)R^c$ であり； R^c が水素； $(C_1 \sim C_8)$ アルキル；またはアリールから選択され；そして R^6 が水素である、化合物。

【請求項 32】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 つの治療有効量の化合物を含む薬学的処方物であって、少なくとも 1 つの薬学的に受容可能な賦形剤と混合されている、薬学的処方物。

【請求項 33】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 34】

酸化ストレスを特徴とする状態の処置または予防のための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の 1 つ以上の化合物の使用。

【請求項 35】

前記状態が、脳卒中；脳虚血；網膜虚血；術後性認知機能障害；末梢神経障害；脊髄損傷；頭部損傷；および外科的外傷から選択される、請求項 34 に記載の使用。

【請求項 36】

前記状態が、炎症性要素または自己免疫性要素を含む、請求項 34 の使用。

【請求項 37】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の 1 つ以上の化合物の使用であって、神経炎症性疾患または神経変性疾患を特徴とする状態の処置または予防のための医薬の製造のための、使用。

【請求項 38】

前記状態が、アルツハイマー病および老年痴呆から選択される、請求項 37 に記載の使用。

【請求項 39】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の 1 つ以上の有効量の化合物を含む、酸化ストレスを特徴とする状態に罹患した哺乳動物の処置のための組成物。

【請求項 40】

請求項 39 に記載の組成物であって、前記状態が、脳卒中；脳虚血；網膜虚血；術後性認知機能障害；末梢神経障害；脊髄損傷；頭部損傷；および外科的外傷から選択される、組成物。

【請求項 41】

前記状態が、炎症性要素または自己免疫性要素を含む、請求項 40 に記載の組成物。

【請求項 42】

前記化合物が以下から選択される、請求項 41 に記載の組成物：

- ・ 3 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (5 - フェニル - 2 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルスルファニル) - 2 - (5 - フェニル - 2 H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニル) - 5 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 3 - ヒドロキシ - 5 - ヒドロキシメチル - 5 H - フラン - 2 - オン；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イルスルファニル) - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (ピリミジン - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ピリミジン - 2 - イルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (2 - スルホ - エチルスルファニル) - 2 - (2 - スルホ - エチルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (7 - トリフルオロメチル - キノリン - 4 - イルスルファニル) - 2 - (7 - トリフルオロメチル - キノリン - 4 - イルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 3 - (ベンゾセレナゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾセレナゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (5 - スルホン酸 - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (5 - スルホン酸 - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (ピロリジン - 1 - カルボチオイルスルファニル) - 2 - (ピロリジン - 1 - カルボチオイルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 3 - シクロヘキシルスルファニル - 2 - シクロヘキシルスルファニルメチル - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 3 - (2 - ジメチルアミノ - エチルスルファニル) - 2 - (2 - ジメチルアミノ - エチルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル, 塩酸塩；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (ピリジン - 4 - イルスルファニル) - 2 - (ピリジン - 4 - イルスルファニルメチル) - 2, 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；

- ・ 5 , 8 - ジクロロ - 3 - ヒドロキシ - 2 - オキソ - 2 H - 1 - オキサ - 4 , 9 - ジチア - ベンゾ [f] アズレン - 1 0 a - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 3 - (5 - クロロ - ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (5 - クロロ - ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ; および
- ・ 3 - (5 - アミノ - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (5 - アミノ - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル。

【請求項 4 3】

前記化合物が以下から選択される、請求項 4 0 に記載の組成物：

- ・ 3 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシ - エチル) - アミド ;
- ・ 3 - (2 , 4 - ジクロロベンジルスルファニル) - 2 - (2 , 4 - ジクロロ - ベンジルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 3 - (5 - アミノ - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (5 - アミノ - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸 ;
- ・ 4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピオニルオキシ) - 3 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニル) - 2 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 3 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 3 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸 ;
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (ピロリジン - 1 - カルボチオイルスルファニル) - 2 - (ピロリジン - 1 - カルボチオイルスルファニルメチル) - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 3 - シクロヘキシルスルファニル - 2 - シクロヘキシルスルファニルメチル - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (ピリジン - 4 - イルスルファニル) - 2 - (ピリジン - 4 - イルスルファニルメチル) - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ;
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (5 - フェニル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (5 - フェニル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル ; および
- ・ 3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル。

【請求項 4 4】

請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の有効量の化合物を含む、神経炎症性疾患または神経変性疾患を特徴とする状態に罹患した哺乳動物の処置のための組成物。

【請求項 4 5】

前記状態が、アルツハイマー病および老年痴呆から選択される、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 4 6】

前記化合物が以下から選択される、請求項 4 4 に記載の組成物：

- ・ 3 - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル) - 2 - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 3 - (5 - メトキシ - ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (5 - メトキシ - ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 2 - (ベンゾチアゾール - 2 - スルフィニルメチル) - 3 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 3 - (6 - ニトロ - ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (6 - ニトロ - ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (2 - メトキシカルボニル - ビニル) - フェニルスルファニル] - 2 - [4 - (2 - メトキシカルボニル - ビニル) - フェニルスルファニルメチル] - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピオニルオキシ) - 3 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニル) - 2 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 3 - (4 - メトキシ - ベンジルスルファニル) - 2 - (4 - メトキシ - ベンジルスルファニルメチル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 2 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - エトキシ - 3 - (1 - エチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルスルファニル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 3 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イルスルファニル) - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イルスルファニルメチル) - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 3 - (4 - メチル - ピリミジン - 2 - イルスルファニル) - 2 - (4 - メチル - ピリミジン - 2 - イルスルファニルメチル) - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 3 - (ピリミジン - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ピリミジン - 2 - イルスルファニルメチル) - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル；および
- ・ 3 - (ベンゾセレナゾール - 2 - イルスルファニル) - 2 - (ベンゾセレナゾール - 2 - イルスルファニルメチル) - 4 - ヒドロキシ - 5 - オキソ - 2 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - カルボン酸エチルエステル。

【請求項 4 7】

上記明細書の発明。