

【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2月12日(2009.2.12)

【公表番号】特表2004-526675(P2004-526675A)

【公表日】平成16年9月2日(2004.9.2)

【年通号数】公開・登録公報2004-034

【出願番号】特願2002-546541(P2002-546541)

【国際特許分類】

C 0 7 D 307/54 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/443 (2006.01)

A 6 1 K 31/4436 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

C 0 7 D 333/24 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 307/54

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/443

A 6 1 K 31/4436

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

C 0 7 D 333/24

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 409/12

【誤訳訂正書】

【提出日】平成20年9月9日(2008.9.9)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】特許請求の範囲

【訂正方法】変更

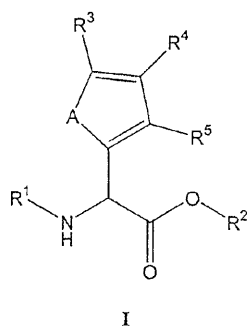
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)

【化1】



{ 式中、

A は酸素又は硫黄を示し、

R^1 はアリール又はヘテロシクリル²を示し、

R^2 は H、メチル、エチル又は t - ブチルを示し、

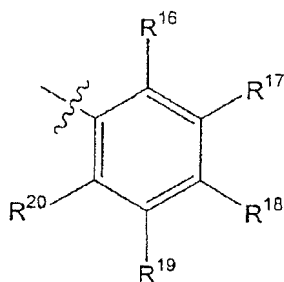
R^3 は H、Cl、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、t - ブチル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2SH$ 、 $-CH_2-S-CH_3$ 、 $-CH_2-S-CH_2-$ フラン - 2 - イル、 $-CH_2-O-(C=O)-CH_3$ 、 $-(CH_2)-S-(C=O)-CH_3$ 、 $-CH_2-S-S-CH_3$ 、 $-CH_2-S-S-CH_2-$ フラン - 2 - イル、 $-CH_2-CO_2$ メチル又は $-CH_2-CO_2$ エチルを示し、

R^4 は H、Br、メチル、エチル、 $-CH_2OH$ 、 $-CO_2$ メチル、 $-CO_2$ エチル又は $-(C=O)-$ メチルを示し、

R^5 は H、メチル又はエチルを示し、

この際、アリールは

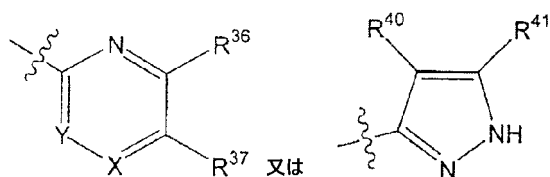
【化 2】



を示し、

ヘテロシクリル²は

【化 3】



を示し、

R^{16} は H、 $-O-$ フェニル、F、Cl、Br、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル又は t - ブチルを示し、

R^{17} は H、Cl、メチル、エチル又は CF_3 を示し、

R^{18} はH、F、Cl、Br、I、-CN、-O-CH₃、-O-CF₃、-O-フェニル、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、2-ブチル又はt-ブチルを示し、

R^{19} はH、Cl、Br、メチル又はエチルを示し、

R^{20} はH又はメチルを示し、

X-YはCR³⁸-CR³⁹、CR³⁸-N又はN-CR³⁹を示し、

R^{36} はH、メチル又はエチルを示し、

R^{37} はH、NO₂、Cl、Br、メチル又はCF₃を示し、

R^{38} はHを示し、

R^{39} はH、Cl又はBrを示し、

R^{40} はH、-N=N-フェニル、-CN、CO₂H、CO₂-メチル又はCO₂-エチルを示し、そして

R^{41} はH、OH、SH、S-メチル、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル又はt-ブチルを示す。}

で表わされる化合物〔但し、(4-メトキシ-フェニルアミノ)-チエン-2-イル-酢酸は除く〕又はその薬学的に許容し得る塩。

【請求項2】

そのラセミ化合物の形に、その純粋な対掌体又はジアステレオマーの形にある、いは任意の混合割合での対掌体又はジアステレオマーの混合物の形にある、請求項1記載の一般式(I)で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩。

【請求項3】

R^1 が4-トリフルオロメトキシ-フェニル、2-フェノキシ-フェニル、4-フェノキシ-フェニル、2-クロロ-フェニル、4-クロロ-フェニル、4-ヨード-フェニル、4-シアノ-フェニル、2-メチル-フェニル、2-エチル-フェニル、4-エチル-フェニル、2-(2-プロピル)-フェニル、4-(2-ブチル)-フェニル、4-t-ブチル-フェニル、2,4-ジクロロフェニル、2,3-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、2,4-ジブromo-フェニル、4-クロロ-2-フルオロ-フェニル、2-クロロ-4-フルオロ-フェニル、4-bromo-2-クロロ-フェニル、2-クロロ-4-ヨード-フェニル、3-クロロ-2-メチル-フェニル、4-クロロ-2-メチル-フェニル、5-クロロ-2-メチル-フェニル、2-クロロ-4-メチル-フェニル、4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル、2,4-ジブromo-5-メチル-フェニル、5-ニトロ-ピリジン-2-イル、3,5-ジブromo-ピリジン-2-イル、3,5-ジクロロ-ピリジン-2-イル、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル、3,5-ジブromo-6-メチル-ピリジン-2-イル、ピラジン-2-イル、5-bromo-ピリミジン-2-イル、4-カルボキシエチル-ピラゾール-3-イル、4-シアノ-ピラゾール-3-イル、5-t-ブチル-ピラゾール-3-イル、5-ヒドロキシ-4-(4-フェニルアゾ)-ピラゾール-3-イル又は4-シアノ-5-メチルスルファニル-ピラゾール-3-イルを示し、

R^2 がH又はエチルを示し、

R^3 がH、Cl、メチル、エチル、n-プロピル、t-ブチル、-CH₂OH、-CH₂SH、-CH₂S-CH₃、-CH₂-S-CH₂-フラン-2-イル、-CH₂-O-(C=O)-CH₃、-(CH₂)-S-(C=O)-CH₃、-CH₂-S-S-CH₃、-CH₂-S-S-CH₂-フラン-2-イル又は-CH₂-CO₂エチルを示し、

R^4 がH、Br、メチル、-CH₂OH、-CO₂メチル、-CO₂エチル又は-(C=O)-メチルを示し、

R^5 がH又はメチルを示す、

請求項1又は2記載の一般式(I)で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩。

【請求項4】

R^1 が3,5-ジクロロフェニルを示し、

R^2 がHを示す、請求項1~3のいずれか1つに記載の一般式(I)で表わされる化合物

又はその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 5】

次の群

- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (5 - ニトロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - 酢酸、
- ・ (5 - プロモピリミジン - 2 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3, 5 - ジクロロピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3, 5 - ジプロモピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3, 5 - ジプロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (3, 5 - ジプロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2, 4 - ジプロモ - 5 - メチル - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - (5 - ニトロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジプロモピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジプロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (5 - プロモピリミジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ 5 - [(3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ (5 - ヒドロキシ - 4 - フェニルアゾ - 1H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ 3 - { [エトキシカルボニル - (4 - エトキシカルボニル - 5 - メチル - フラン - 2 - イル) - メチル] - アミノ } - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - シアノ - 5 - メチルスルファニル - 1H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - シアノ - 1H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - プロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - シアノ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - (5 - ヒドロキシ - 4 - フェニルアゾ - 1H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - シアノ - 5 - メチルスルファニル - 1H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - プロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、

- ・ (5 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 4 - ジブロモ - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 - エチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - s - ブチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (4 - トリフルオロメトキシ - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (2 - イソプロピル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 , 4 - ジブロモ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - t - ブチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ (2 - エチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ (4 - s - ブチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - (2 - イソプロピル - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (4 - t - ブチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(2 - クロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、

- ・ (4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジブromo - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジブromo - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジブromo - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ 5 - [(4 - ブromo - 2 - クロロ - フェニルアミノ) カルボキシ - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - シアノ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (2 - フェノキシ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - ブromo - 2 - クロロ - フェニルアミノ) カルボキシ - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - シアノ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - ブromo - 2 - クロロ - フェニルアミノ) カルボキシ - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - シアノ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (5 - t - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - ブromo - 2 - クロロ - フェニルアミノ) - (3 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - シアノ - フェニルアミノ) - (3 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (3 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (5 - エトキシカルボニルメチル - チオフェン - 2 - イル) - (5 - ヒドロキシ - 4 - フェニルアゾ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ { 5 - [1 - (4 - シアノ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - 3 - メトキシ - 2 - オキソ - プロピル] - チオフェン - 2 - イル } - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - エチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

ル) - 酢酸、

・ (3 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (4 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - o - トリルアミノ - 酢酸、

・ 5 - [カルボキシ - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、

・ 5 - [カルボキシ - (2 - クロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、

・ 5 - [カルボキシ - (2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、

・ 5 - [カルボキシ - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、

・ 5 - [カルボキシ - (2, 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、

・ (2, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、

・ (4 - ヨード - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2 - クロロ - 4 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2, 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (2 - クロロ - 4 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - (5 - エトキシカルボニルメチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (4 - アセチル - 3, 5 - ジメチル - フラン - 2 - イル) - (2 - クロロ - 4 - メチル

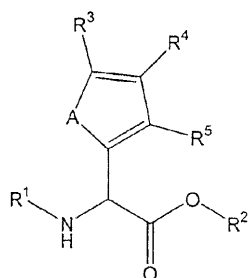
- フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (4 - アセチル - 3, 5 - ジメチル - フラン - 2 - イル) - (2, 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - ヒドロキシメチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - アセチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - エチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - n - プロピル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - [(5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル)] - 酢酸、
- ・ (3 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (チオフェン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - プロモフラン - 2 - イル) - (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - プロピルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (3 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (5 - t - ブチルフラン - 2 - イル) - (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - [(5 - (フラン - 2 - イルメチルジスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル)] - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - (5 - メチルジスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - [(5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル)] - 酢酸、
- ・ 5 - アセトキシメチルフラン - 2 - イル - (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - チオフェン - 3 - イル - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - (5 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - (4 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸及び
- ・ (5 - クロロチオフェン - 2 - イル) - (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - 酢酸が

ら選ばれることを特徴とする、請求項 1 又は 2 記載の一般式 (I) で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 6】

一般式 (I)

【化 4】



I

{ 式中、

A は酸素又は硫黄を示し、

R^1 はアリール又はヘテロシクリル²を示し、

R^2 は H、メチル、エチル又は t-ブチルを示し、

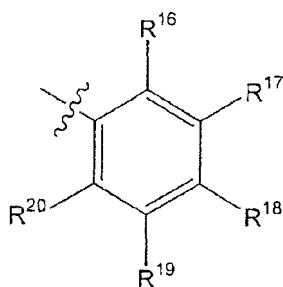
R^3 は H、Cl、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{SH}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2$ -フラン-2-イル、 $-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{CH}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)-\text{S}-(\text{C}=\text{O})-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-\text{S}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-\text{S}-\text{CH}_2$ -フラン-2-イル、 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2$ メチル又は $-\text{CH}_2-\text{CO}_2$ エチルを示し、

R^4 は H、Br、メチル、エチル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CO}_2$ メチル、 $-\text{CO}_2$ エチル 又は $-(\text{C}=\text{O})-\text{メチル}$ を示し、

R^5 は H、メチル又はエチルを示し、

この際、アリールは

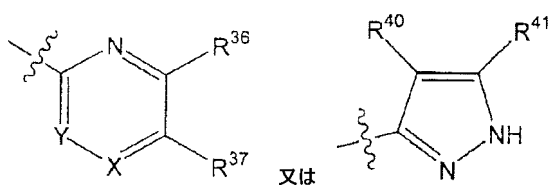
【化 5】



を示し、

ヘテロシクリル²は

【化 6】



を示し、

R^{16} はH、-O-フェニル、F、Cl、Br、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル又はt-ブチルを示し、

R^{17} はH、Cl、メチル、エチル又は CF_3 を示し、

R^{18} はH、F、Cl、Br、I、-CN、-O- CH_3 、-O- CF_3 、-O-フェニル、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、2-ブチル又はt-ブチルを示し、

R^{19} はH、Cl、Br、メチル又はエチルを示し、

R^{20} はH又はメチルを示し、

X-Yは $CR^{38}-CR^{39}$ 、 $CR^{38}-N$ 又は $N-CR^{39}$ を示し、

R^{36} はH、メチル又はエチルを示し、

R^{37} はH、 NO_2 、Cl、Br、メチル又は CF_3 を示し、

R^{38} はHを示し、

R^{39} はH、Cl又はBrを示し、

R^{40} はH、-N=N-フェニル、-CN、 CO_2H 、 CO_2 -メチル又は CO_2 -エチルを示し、そして

R^{41} はH、OH、SH、S-メチル、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル又はt-ブチルを示す。}

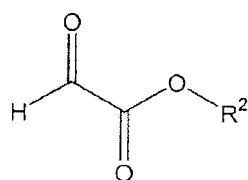
で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を製造するにあたり、一般式(II)

R^1-NH_2 II

(式中、 R^1 は上記に定義された通りである。)

で表わされるアミンを一般式(III)

【化7】

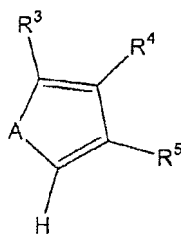


III

(式中、 R^2 は上記に定義された通りである。)

で表わされるグリオキシル酸誘導体及び一般式(IV)

【化8】



IV

(式中、A、 R^3 、 R^4 及び R^5 は上記に定義された通りである。)

で表わされるヘテロ環と酸の作用下に反応させる、上記一般式(I)で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩の製造方法。

【請求項7】

一槽反応として実施する、請求項6記載の方法。

【請求項8】

化合物(II)、(III)及び(IV)の反応をマイクロ波照射の作用下に実施する、

請求項 6 又は 7 記載の方法。

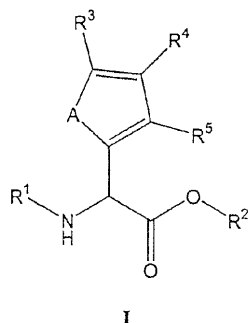
【請求項 9】

上記処理を有機溶剤中で 0 ~ 100 の温度で実施する、請求項 6 ~ 8 のいずれか 1 つに記載の方法。

【請求項 10】

一般式 (I)

【化 9】



{ 式中、

A は酸素又は硫黄を示し、

R¹ はアリールを示し、

R² は H、メチル、エチル又は t - ブチルを示し、

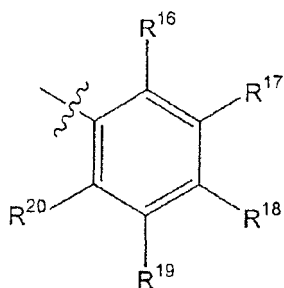
R³ は H、Cl、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、t - ブチル、- CH₂OH、- CH₂SH、- CH₂-S-CH₃、- CH₂-S-CH₂-フラン - 2 - イル、- CH₂-O-(C=O)-CH₃、-(CH₂)-S-(C=O)-CH₃、- CH₂-S-S-CH₃、- CH₂-S-S-CH₂-フラン - 2 - イル、- CH₂-CO₂メチル又は - CH₂-CO₂エチルを示し、

R⁴ は H を示し、

R⁵ は H を示し、

この際、アリールは

【化 10】



を示し、

R¹⁶ は H、- O - フェニル、F、Cl、Br、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル又は t - ブチルを示し、

R¹⁷ は H、Cl、メチル、エチル又は CF₃を示し、

R¹⁸ は H、F、Cl、Br、I、- CN、- O-CH₃、- O-CF₃、- O-フェニル、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、2 - ブチル又は t - ブチルを示し、

R¹⁹ は H、Cl、Br、メチル又はエチルを示し、

R²⁰ は H 又はメチルを示す。}

で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を含有する、痛み又は偏頭痛の治療用

医薬。

【請求項 1 1】

請求項 1 0 に定義した一般式 (I) で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を 痛み の治療用医薬の製造に使用する方法。

【請求項 1 2】

請求項 1 0 に定義した一般式 (I) で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を偏頭痛の治療用医薬の製造に使用する方法。

【請求項 1 3】

少なくとも 1 種の請求項 1 0 に定義した一般式 (I) で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩並びに少なくとも 1 種の薬学的助剤を含有する、痛み又は偏頭痛の治療用 薬学的調合物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 1】

本発明は、置換されたアミノ - フラン - 2 - イル - 酢酸 - 及び置換されたアミノ - チエン - 2 - イル - 酢酸 - 誘導体、その製造方法、この化合物を含有する医薬並びにこの化合物を特に 痛み 又は偏頭痛の治療用医薬の製造に使用する方法及びこれを含有する薬学的調合物に関する。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 2】

慢性及び 非慢性痛 状態の治療は医療において重要な意味を有する。したがって慢性及び 非慢性痛 状態の患者に合い、かつ目的にかなった治療への十分に有効な治療が世界的に要求されている。但しこの場合これは患者に対して効果があり、そして満足のいく 痛み 治療を意味する。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 3】

モルフィンのような古典的オピオイドは強い 痛み ないし著しく強い 痛み の治療に十分に有効である。しかしこれらはその使用は所望されない副作用、たとえば呼吸抑制、嘔吐、鎮静、便秘及び耐薬性の発生によって制限される。更にこれは特に腫瘍患者が 煩う 神経障害性又は付随する痛みによりあまり有効でない。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 4】

オピオイドは細胞膜に存在するレセプターと結合することによってその鎮痛作用を発揮する。このレセプターはいわゆる G - 蛋白質結合レセプターのファミリーに属する。それと共に、痛み の発生系及び 痛み の更なる伝達系に著しく関与するその他のレセプター及び

イオンチャネル、たとえばN - メチル - D - アスパルタート - (N M D A) - イオンチャネルが存在し、これを介してシナプスの伝達の重要な部分が流出し、そしてそれによってカルシウムイオン交換が神経細胞とその周囲の間で調節される（たとえばP.D. Leeson, L.L. Iversen, J. Med. Chem. 37 (1994) 4053-4067参照）。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 6】

本発明が基礎とする課題は、痛みの治療に適当である新規化合物を提供することにある。さらにこれらの化合物は、通常オピオイド、たとえばモルフィンを使用した場合に生じるその副作用、たとえばむかつき、嘔吐、依存、呼吸抑制又は便秘を可能なかぎり引き起こさない又は僅かな程度でしか引き起こさないことが所望される。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 3 5】

典型的な好ましい本発明の化合物は、

- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (5 - ニトロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - 酢酸、
- ・ (5 - ブロモピリミジン - 2 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジブロモピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジブロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (3 , 5 - ジブロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 , 4 - ジブロモ - 5 - メチル - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - (5 - ニトロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジブロモピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジブロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (5 - ブロモピリミジン - 2 - イルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ 5 - [(3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ (5 - ヒドロキシ - 4 - フェニルアゾ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、

- ・ 3 - { [エトキシカルボニル - (4 - エトキシカルボニル - 5 - メチル - フラン - 2 - イル) - メチル] - アミノ } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - シアノ - 5 - メチルスルファニル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - シアノ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - ブロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - シアノ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - (5 - ヒドロキシ - 4 - フェニルアゾ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - シアノ - 5 - メチルスルファニル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - ブロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (5 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 4 - ジブロモ - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 - エチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - s - ブチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (4 - トリフルオロメトキシ - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (2 - イソプロピル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 , 4 - ジブロモ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - t - ブチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ (2 - エチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ (4 - s - ブチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - (2 - イソプロピル - フェニルアミノ) - 酢酸、
- ・ (4 - t - ブチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、

- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(2 - クロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [エトキシカルボニル - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - エトキシカルボニル - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジブロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジブロモ - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジブロモ - 6 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ 5 - [(4 - ブロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) カルボキシ - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - シアノ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (2 - フェノキシ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - ブロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) カルボキシ - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - シアノ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 , 4 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [(4 - ブロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) カルボキシ - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - シアノ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン

- 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (5 - t - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - (4 - ヒドロキシメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - ブロモ - 2 - クロロ - フェニルアミノ) - (3 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - シアノ - フェニルアミノ) - (3 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (3 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - (4 - フェノキシ - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ (5 - エトキシカルボニルメチル - チオフェン - 2 - イル) - (5 - ヒドロキシ - 4 - フェニルアゾ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - 酢酸エチルエステル、
- ・ { 5 - [1 - (4 - シアノ - 1 H - ピラゾール - 3 - イルアミノ) - 3 - メトキシ - 2 - オキソ - プロピル] - チオフェン - 2 - イル } - 酢酸エチルエステル、
- ・ (4 - エチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (3 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - o - トリルアミノ - 酢酸、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (2 - クロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [カルボキシ - (2 , 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - メチル] - 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ (2 , 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - (4 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 , 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - フラン - 2 - イル - 酢酸、
- ・ (4 - ヨード - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 , 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (2 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、
- ・ (4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フ

ラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2 - クロロ - 4 - メチル - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (2, 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - (4 - ヨード - フェニルアミノ) - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 2 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (2 - クロロ - 4 - メチル - フェニルアミノ) - [5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ) - (5 - エトキシカルボニルメチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (4 - アセチル - 3, 5 - ジメチル - フラン - 2 - イル) - (2 - クロロ - 4 - メチル - フェニルアミノ) - 酢酸、

・ (4 - アセチル - 3, 5 - ジメチル - フラン - 2 - イル) - (2, 3 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - ヒドロキシメチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (5 - アセチルスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - エチル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - n - プロピル - チオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - [(5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (3 - クロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 4 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - メルカプトメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (チオフェン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、

・ (4 - プロモフラン - 2 - イル) - (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸エチルエステル、

・ (3, 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (5 - プロピルチオフェン - 2 - イル) - 酢

酸エチルエステル、

・ (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - (3 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸エチルエステル、

・ (5 - t - ブチルフラン - 2 - イル) - (3 , 5 - ジクロロ - フェニルアミノ) - 酢酸、

・ (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - [(5 - (フラン - 2 - イルメチルジスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - (5 - メチルジスルファニルメチル - フラン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - [(5 - (フラン - 2 - イルメチルスルファニルメチル) - フラン - 2 - イル] - 酢酸、

・ 5 - アセトキシメチルフラン - 2 - イル - (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - 酢酸

、
・ (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - チオフェン - 3 - イル - 酢酸、

・ (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - (5 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - (4 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 酢酸、

・ (5 - クロロチオフェン - 2 - イル) - (3 , 5 - ジクロロフェニルアミノ) - 酢酸

並びにその薬学的に許容し得る塩を含有する群から選ばれる。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0049

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0049】

この本発明の医薬は痛みの状態、たとえば急性痛、慢性痛又は神経障害性痛の治療に使用されるのが好ましい。本発明の医薬は偏頭痛、炎症反応及び（又は）アレルギー反応、鬱病、薬物乱用及び（又は）アルコール乱用、胃炎、下痢、尿失禁、心臓血管系疾患、呼吸器系疾患、咳、精神疾患、神経変性障害、癲癇、統合失調症、アルツハイマー病、ハンチントン病、パーキンソン病、脳虚血、脳梗塞、高められたアミノ酸レベルに起因する精神病、卒中発作、脳浮腫、中枢神経系の供給不足状態、低酸素症、無酸素症、AIDS - 痴呆症、脳炎、ツレット症候群、周産期仮死の治療に又は抗不安に使用することができることも分かった。

【誤訳訂正 9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0050

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0050】

本発明のもう一つの対象は、少なくとも1種の一般式 (I - A) で表わされるアミノ - フラン - 2 - イル - 酢酸 - 誘導体又は一般式 (I - B) で表わされるアミノ - チエン - 2 - イル - 酢酸 - 誘導体を、痛み、偏頭痛、炎症反応及び（又は）アレルギー反応、鬱病、薬物乱用及び（又は）アルコール乱用、胃炎、下痢、尿失禁、心臓血管系疾患、呼吸器系疾患、咳、精神疾患、神経変性障害、癲癇、精神分裂病、アルツハイマー病、ハンチントン病、パーキンソン病、脳虚血、脳梗塞、高められたアミノ酸レベルに起因する精神病、卒中発作、脳浮腫、中枢神経系の供給不足状態、低酸素症、無酸素症、AIDS - 痴呆症、脳炎、ツレット症候群、周産期仮死の治療用医薬又は抗不安用医薬の製造に使用する方法にもある。