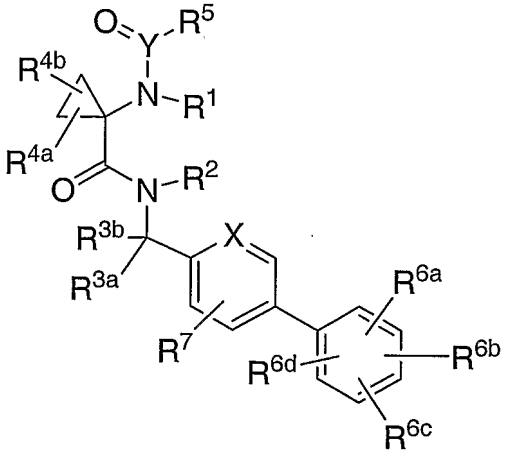
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成19年6月21日(2007.6.21)

【公表番号】特表2007-501790(P2007-501790A)
【公表日】平成19年2月1日(2007.2.1)
【年通号数】公開・登録公報2007-004
【出願番号】特願2006-522671(P2006-522671)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 215/58　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 239/24　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/505　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/255　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/18　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/541　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/165　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/47　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/34　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/10　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 215/58
Ｃ０７Ｄ 239/24　ＣＳＰ

Ｃ０７Ｄ 417/12
Ａ６１Ｋ 31/505
Ａ６１Ｋ 31/255
Ａ６１Ｋ 31/18
Ａ６１Ｋ 31/541
Ａ６１Ｋ 31/165
Ａ６１Ｋ 31/47
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 15/08
Ａ６１Ｐ 29/00 １０１
Ａ６１Ｐ 19/02
Ａ６１Ｐ 19/06
Ａ６１Ｐ 19/08
Ａ６１Ｐ 37/08
Ａ６１Ｐ 11/06
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 27/16
Ａ６１Ｐ 25/34
Ａ６１Ｐ 1/04
Ａ６１Ｐ 1/18
Ａ６１Ｐ 13/12
Ａ６１Ｐ 13/10
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 1/16
Ａ６１Ｐ 9/10 １０１
Ａ６１Ｐ 9/04
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 25/08
Ａ６１Ｐ 31/04
Ａ６１Ｐ 25/06
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 19/10

【手続補正書】
【提出日】平成19年4月26日(2007.4.26)
【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の化合物および薬剤として許容されるその塩：

【化１】

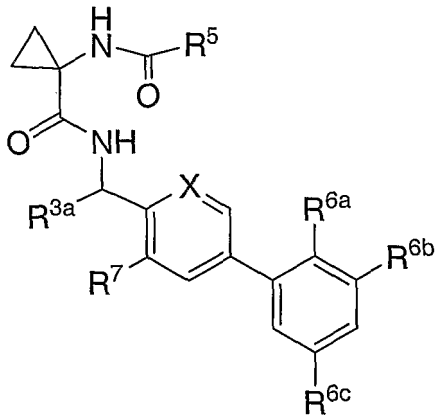


I

（式中、R^1およびR^2は、独立に、水素および$C_{1\sim4}$アルキルから選択され、
R^{3a}およびR^{3b}は、独立に、水素および１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1\sim4}$アルキルから選択され、
R^{4a}およびR^{4b}は、独立に、水素、ハロゲンならびにハロゲン、OR^a、$OC(O)R^a$、$S(O)_kR^d$、$OS(O)_2R^d$およびNR^1R^2から選択される１～４個の基で場合によって置換された$C_{1\sim4}$アルキルから選択され、または
R^{4a}およびR^{4b}は、それらが共に結合する炭素原子と一緒に、１～５個のハロゲンで場合によって置換された$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim4}$アルキルオキシから選択される１～２個の基で場合によって置換された環外メチレンを形成し、
R^5は、（１）ハロゲン、ニトロ、シアノ、OR^a、SR^a、COR^a、SO_2R^d、CO_2R^a、$OC(O)R^a$、NR^bR^c、$NR^bC(O)R^a$、$NR^bC(O)_2R^a$、$C(O)NR^bR^c$、$C_{3\sim8}$シクロアルキルから独立に選択される１～５個の基で場合によって置換された$C_{1\sim6}$アルキル、（２）ハロゲン、ニトロ、シアノおよびフェニルから独立に選択される１～５個の基で場合によって置換された$C_{3\sim8}$シクロアルキル、（３）$C_{3\sim6}$アルキニル、（４）ヒドロキシエチルで場合によって置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、（５）ハロゲン、ニトロ、シアノ、OR^a、SR^a、$C(O)_2R^a$、$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim3}$ハロアルキルから独立に選択される１～３個の基で場合によって置換された$(CH_2)_k$－アリール、（６）ハロゲン、ニトロ、シアノ、OR^a、SR^a、$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim3}$ハロアルキルから独立に選択される１～３個の基で場合によって置換された$(CH_2)_k$－複素環（ここで、前記複素環は、（ａ）Ｎ、ＯおよびＳから選択される環ヘテロ原子を有し、３個までのさらなる環窒素原子を場合によって有する５員複素環式芳香族環（前記環は、場合によってベンゾ縮合されている）、（ｂ）１～３個の環窒素原子およびそのＮ酸化物を含む６員複素環式芳香族環（前記環は、場合によってベンゾ縮合されている）ならびに（ｃ）テトラヒドロフラニル、５－オキソテトラヒドロフラニル、２－オキソ－２Ｈ－ピラニル、６－オキソ－１，６－ジヒドロピリダジニルから選択される５員または６員非芳香族複素環から選択されている）、（７）$C(O)_2R^a$ならびに（８）$C(O)NR^bR^c$から選択され、
R^{6a}は、（１）$-OSO_2R^8$、（２）$-NR^{8a}SO_2R^9$および（３）$-C(R^{8b})(R^{8c})SO_2R^9$から選択され、
R^{6b}、R^{6c}およびR^{6d}は、（１）水素、（２）ハロゲン、（３）OSO_2R^8、（４）１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1\sim4}$アルキル、（５）シアノ、（６）ニトロ、（７）OR^aおよび（８）CO_2R^aから独立に選択され、または隣接炭素原子に結合する場合は、R^{6c}およびR^{6d}はそれらが結合する炭素原子と一緒に、５～８員の飽和もしくは不飽和環を形成し、
R^7は、（１）水素、（２）ハロゲン、（３）シアノ、（４）ニトロ、（５）OR^a、

（６）CO_2R^a、（７）C（O）NR^bR^cおよび（８）１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキルから選択され、
R^8は、（１）１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキル、（２）ハロゲン、ニトロ、シアノ、$NR^aC(O)R^a$、OR^a、SR^a、CO_2R^a、$C_{1～4}$アルキル、$C_{1～3}$ハロアルキルおよびNR^bR^cから独立に選択される１～３個の基で場合によって置換された$(CH_2)_k$－アリール、（３）NR^bR^cならびに（４）水素から選択され、
R^{8a}は、水素、１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキル、ハロゲンおよびCO_2R^aから選択され、または
R^{6a}およびR^{6b}が隣接原子に結合する場合は、R^{8a}およびR^{6b}は、一緒に５員または６員環を完成し、
R^{8b}およびR^{8c}は、水素、１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、CO_2R^aおよびOR^aから独立に選択され、
R^9は、（１）１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキル、（２）ハロゲン、ニトロ、シアノ、$NR^aC(O)R^a$、OR^a、SR^a、CO_2R^a、$C_{1～4}$アルキルおよび$C_{1～3}$ハロアルキルから独立に選択される１～３個の基で場合によって置換されたアリール、ならびに（３）ハロゲン、ニトロ、シアノ、$NR^aC(O)R^a$、OR^a、SR^a、$C(O)_2R^a$、$C_{1～4}$アルキルおよび$C_{1～3}$ハロアルキルから独立に選択される１～３個の基で場合によって置換された$(CH_2)_k$－アリールから選択され、または
R^{8a}およびR^9は、それらが結合する原子と一緒に、５～８員複素環を形成し、
R^a、R^bおよびR^cは、（１）水素、（２）１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキル、（３）ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、$C_{1～4}$アルキルオキシ、$C_{3～6}$シクロアルキルおよび１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキルから選択される１～３個の基で場合によって置換されたフェニル、ならびに（４）$C_{3～6}$シクロアルキルから独立に選択され、または
R^bおよびR^cは、それらが結合する窒素原子と一緒に、N、OおよびSから選択されるさらなるヘテロ原子を場合によって含む４－、５－もしくは６－員環を形成し、または
R^bおよびR^cは、それらが結合する窒素原子と一緒に環状イミドを形成し、
R^dは、（１）１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキル、（２）$C_{1～4}$アルキルオキシ、（３）ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、$C_{1～4}$アルキルオキシ、$C_{3～6}$シクロアルキルおよび１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1～4}$アルキルから選択される１～３個の基で場合によって置換されたフェニル、ならびに（４）水素から選択され、
Xは、CHおよびNから選択され、
Yは、CおよびS＝Oから選択され、
kは、０、１および２から選択されている）。
【請求項２】
R^5が、ハロゲンから独立に選択される１～５個の基で場合によって置換されたピリミジニルおよび$C_{1～6}$アルキルから選択される請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
YがCである請求項１に記載の化合物。
【請求項４】
R^{6a}がOSO_2R^8であり、R^8が２，２，２－トリフルオロエチル、トリフルオロメチル、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フェニル、ベンジルおよびジメチルアミノから選択され、またはR^{6a}が$NHSO_2R^9$であり、R^9がメチルもしくはトリフルオロメチルである請求項１に記載の化合物。
【請求項５】
R^{6b}が、水素、フッ素および塩素から選択される請求項１に記載の化合物。

【請求項６】
式Ｉ（２）を有する請求項１に記載の化合物：
【化２】



I(2)

（式中、ＸはＮまたはＣＨであり、R^{3a}はＨまたは$C_{1\sim4}$アルキルであり、R^{7}は水素またはハロゲンであり、R^{5}、R^{6a}、R^{6b}およびR^{6c}は、請求項１と同様の定義を有する）。
【請求項７】
R^{6a}が$NHSO_2R^{9}$であり、R^{9}が、１～５個のハロゲン原子で場合によって置換された$C_{1\sim4}$アルキルであり、R^{6b}がハロゲンであり、R^{6c}が水素またはハロゲンである請求項６に記載の化合物。
【請求項８】
R^{6a}がOSO_2R^{8}であり、R^{8}が、メチル、トリフルオロメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ベンジル、ジメチルアミノ、２，２，２－トリフルオロエチルおよびフェニルから選択され、R^{6b}が水素またはハロゲンであり、R^{6c}が水素またはハロゲンである請求項１０に記載の化合物。
【請求項９】
R^{5}が、ハロゲンから独立に選択される１～５個の基で場合によって置換されたピリミジニルまたは$C_{1\sim4}$アルキルである請求項１０に記載の化合物。
【請求項１０】
３，３’－ジフルオロ－４’－｛［（｛１－［（ピリミジン－５－イルカルボニル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］メチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　トリフルオロメタンスルホネート、
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　トリフルオロメタンスルホネート、
３，３’－ジフルオロ－４’－（（１Ｒ）－１－｛［（１－｛［（トリフルオロメチル）スルホニル］アミノ｝シクロプロピル）カルボニル］アミノ｝エチル）－１，１’－ビフェニル－２－イル　トリフルオロメタンスルホネート、
１－（｛［（１Ｒ）－１－（３，３’－ジフルオロ－２’－｛［（トリフルオロメチル）スルホニル］オキシ｝－１，１’－ビフェニル－４－イル）エチル］アミノ｝カルボニル）－シクロプロパンアミニウム　トリフルオロアセテート，
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　メタンスルホネート、
５－クロロ－３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　トリフルオロメタンスルホネート、

３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　エタンスルホネート、
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　プロパン－１－スルホネート
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　プロパン－２－スルホネート、
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　ベンゼンスルホネート、
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　フェニルメタンスルホネート
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　ジメチルスルファメート、
３，３’－ジフルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　２，２，２－トリフルオロエタンスルホネート、
３－クロロ－３’－フルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－１，１’－ビフェニル－２－イル　トリフルオロメタンスルホネート、
３’－フルオロ－４’－｛（１Ｒ）－１－［（｛１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロピル｝カルボニル）アミノ］エチル｝－２－｛［（トリフルオロメチル）スルホニル］オキシ｝－１，１’－ビフェニル－３－イル　トリフルオロメタンスルホネート、
Ｎ－（１－｛［（（１Ｒ）－１－｛３，３’－ジフルオロ－２’－［メチル（メチルスルホニル）アミノ］－１，１’－ビフェニル－４－イル｝エチル）アミノ］－カルボニル｝シクロプロピル）ピリミジン－５－カルボキサミド、
Ｎ－（１－｛［（｛３，３’－ジフルオロ－２’－［（メチルスルホニル）アミノ］－１，１’－ビフェニル－４－イル｝メチル）アミノ］カルボニル｝－シクロプロピル）ピリミジン－５－カルボキサミド、
Ｎ－｛１－［（｛［２’－（１，１－ジオキシド－１，２－チアジナン－２－イル）－３，３’－ジフルオロ－１，１’－ビフェニル－４－イル］メチル｝アミノ）カルボニル］－シクロプロピル｝ピリミジン－５－カルボキサミド、
Ｎ－［（１Ｒ）－１－（３，３’－ジフルオロ－２’－｛［（トリフルオロメチル）スルホニル］メチル｝－１，１’－ビフェニル－４－イル）エチル］－１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロパンカルボキサミド、
Ｎ－［（１Ｒ）－１－（３，３’－ジフルオロ－２’－｛［（トリフルオロメチル）スルホニル］アミノ｝－１，１’－ビフェニル－４－イル）エチル］－１－［（トリフルオロアセチル）アミノ］シクロプロパンカルボキサミド、および
Ｎ－（１－｛［（（１Ｒ）－１－｛３，３’－ジフルオロ－２’－［（メチルスルホニル）アミノ］－１，１’－ビフェニル－４－イル｝エチル）アミノ］カルボニル｝－シクロプロピル）ピリミジン－５－カルボキサミド
から選択される化合物。

【請求項１１】

請求項１に記載の化合物の治療有効量および薬剤として許容される担体を含む薬剤組成物。

【請求項１２】
疼痛および炎症の治療または予防のための薬剤の製造における請求項１に記載の化合物または薬剤として許容されるその塩の使用。
【請求項１３】
前記疼痛が、帯状疱疹後神経障害、変形性関節症の疼痛または歯痛である請求項１２に記載の使用。