

【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1月25日(2007.1.25)

【公表番号】特表2006-507329(P2006-507329A)

【公表日】平成18年3月2日(2006.3.2)

【年通号数】公開・登録公報2006-009

【出願番号】特願2004-552424(P2004-552424)

【国際特許分類】

C 0 7 C	275/42	(2006.01)
A 6 1 K	31/185	(2006.01)
A 6 1 K	31/196	(2006.01)
A 6 1 K	31/36	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
A 6 1 K	31/416	(2006.01)
A 6 1 K	31/4245	(2006.01)
A 6 1 K	31/4402	(2006.01)
A 6 1 P	1/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/08	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/06	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(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	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 C	309/51	(2006.01)
C 0 7 D	209/40	(2006.01)
C 0 7 D	213/75	(2006.01)
C 0 7 D	231/56	(2006.01)
C 0 7 D	257/04	(2006.01)
C 0 7 D	271/06	(2006.01)
C 0 7 D	317/66	(2006.01)

**C 0 7 D 333/36 (2006.01)**

**【 F I 】**

C 0 7 C	275/42	C S P
A 6 1 K	31/185	
A 6 1 K	31/196	
A 6 1 K	31/36	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/41	
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/4402	
A 6 1 P	1/06	
A 6 1 P	1/08	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	9/02	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	13/06	
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/30	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 C	309/51	
C 0 7 D	209/40	
C 0 7 D	213/75	
C 0 7 D	231/56	
C 0 7 D	257/04	F
C 0 7 D	271/06	
C 0 7 D	317/66	
C 0 7 D	333/36	

**【 手続補正書 】**

**【 提出日 】** 平成18年11月8日 (2006.11.8)

**【 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

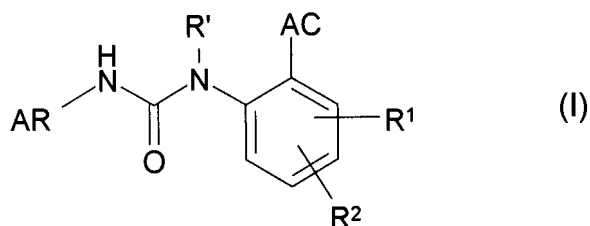
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1】



{ 式中、

AC は、

-SO<sub>2</sub>OH;

-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>;

式 -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOH (式中、n は0, 1, 2 又は3である。) で表わされる基;

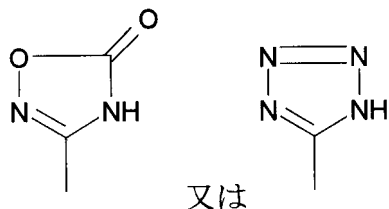
式 -(CX)OH

(式中、X はO 又はNR' を示し、この際R' は水素又はアルキルを示すか又はX はR' と一緒になってヘテロ環状環を形成する。)

で表わされる基; 及び

構造

【化2】



で表わされるヘテロ環状環から選ばれる酸性基を示し、

そして

R' は水素又はアルキルを示すか; 又は

R' 及び Xは一緒になってヘテロ環状環を形成し、そして

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は相互に独立して水素, ハロ, アルキル, シクロアルキル, シクロアルキル-アルキル, ハロアルキル, ニトロ又はシアノを示し、そして

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> のうちの一方が水素を示す場合, R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> のうちの他方は水素と異なり、そして

AR は芳香族単環状, 二環状又は多環状の炭素環状又はヘテロ環状基を示し、

この芳香族基は場合によりハロ, アルキル, シクロアルキル, シクロアルキル-アルキル, アルケニル, アルキニル, ヒドロキシ, アルコキシ, オキソ, ハロアルキル, ニトロ, シアノ, フェニル又はベンジルより成る群から選ばれた置換基によって1回以上置換されているか、又は

この芳香族基は場合によりメチレンジオキシ基又は構造 -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O- (式中、m は1, 2 又は3である。) で表わされる高級同族体によって置換されている。}

で表わされるアリールウレイド誘導体、又はそのあらゆる対掌体又はその対掌体のあらゆる混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩。

【請求項2】

AR が芳香族単環状, 二環状又は多環状の炭素環状基を示し、

この芳香族炭素環状基が場合によりハロ, アルキル, シクロアルキル, シクロアルキル-アルキル, アルケニル, アルキニル, ヒドロキシ, アルコキシ, オキソ, ハロアルキル,

ニトロ，シアノ，フェニル又はベンジルより成る群から選ばれた置換基によって1回以上置換されているか、又は

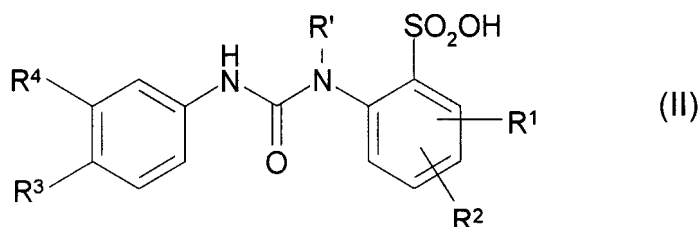
この芳香族基が場合によりメチレンジオキシ基又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体によって置換されている、

請求項1記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項3】

式 II

【化3】



{ 式中、

$R'$  が水素又はアルキルを示すか、又は

$R^1$  及び  $R^2$  が相互に独立して水素，ハロ，アルキル，シクロアルキル，シクロアルキル-アルキル，ハロアルキル，ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  のうちの一方が水素示す場合、 $R^1$  及び  $R^2$  のうち他方は水素と異なり、そして  $R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素，ハロ，アルキル，シクロアルキル，シクロアルキル-アルキル，アルケニル，アルキニル，ヒドロキシ，アルコキシ，オキソ，ハロアルキル，ニトロ，シアノ，フェニル又はベンジルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってメチレンジオキシ環又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体を形成するか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ，アルキル，シクロアルキル，シクロアルキル-アルキル，アルケニル，アルキニル，ヒドロキシ，アルコキシ，オキソ，ハロアルキル，ニトロ，シアノ，フェニル又はベンジルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。}

で表わされる、請求項2記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項4】

$R'$  が水素又はアルキルを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  が相互に独立して水素，ハロ，アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  のうちの一方が水素である場合、 $R^1$  及び  $R^2$  の他方は水素と異なり、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素，ハロ，ヒドロキシ，アルコキシ，オキソ，ハロアルキル，ニトロ，シアノ又はフェニルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になって構造  $-O-CH_2-O-$  で表わされるメチレンジオキシ環を形成するか、又は

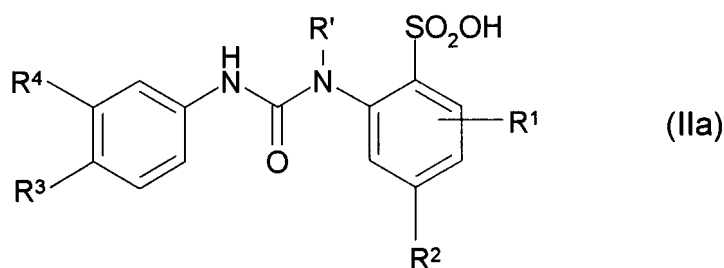
$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ，ヒドロキシ，アルコキシ及びハロアルキルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている、

請求項3記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項5】

式 IIa

## 【化 4】



{ 式中、

$R'$  が水素又はアルキルを示し、そして

$R^1$  が水素、ハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

$R^2$  がハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルキルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になって構造  $-O-CH_2-O-$  で表わされるメチレンジオキシ環を形成するか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、ヒドロキシ、アルコキシ及びハロアルキルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。

}

で表わされる、請求項4記載のアリールウレイド誘導体。

## 【請求項 6】

2-[3-(3-ブromo-フェニル)-ウレイド]-4-クロロ-5-メチル-ベンゼンスルホン酸；

4-クロロ-5-メチル-2-[3-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-ウレイド]-ベンゼンスルホン酸；

4-クロロ-2-[3-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-ウレイド]-ベンゼンスルホン酸；

2-[3-(3-ブromo-フェニル)-ウレイド]-4-クロロ-ベンゼンスルホン酸又は

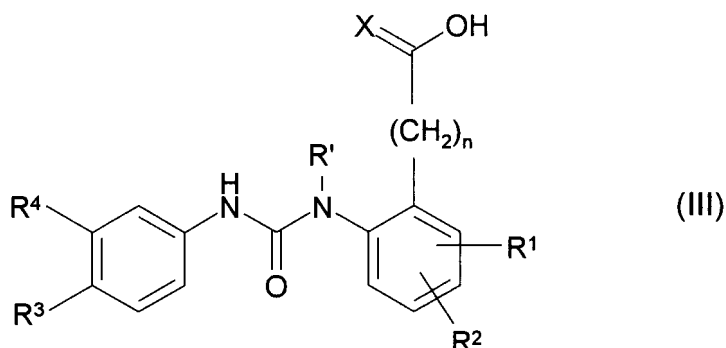
4-クロロ-5-メチル-2-(3-ナフタレン-2-イル-ウレイド)-ベンゼンスルホン酸

又はその対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項5記載のアリールウレイド誘導体。

## 【請求項 7】

式 III

## 【化 5】



{ 式中、

$n$  が0、1又は2であり、

$X$  がO又は $NR''$ を示し、この際 $R''$ は水素又はアルキルを示すか、又は

$R'$  及び $X$ が一緒になってヘテロ環状環を形成し、そして

$R'$  が水素又はアルキルを示すか、又は

$R'$  及び $X$ が一緒になってヘテロ環状環を形成し、そして

$R^1$  及び $R^2$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^1$  及び $R^2$  のうちの一方が水素を示す場合、 $R^1$  及び  $R^2$  のうちの他方は水素と異なり、そ

して

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってメチレンジオキシ環又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体を形成するか、又は

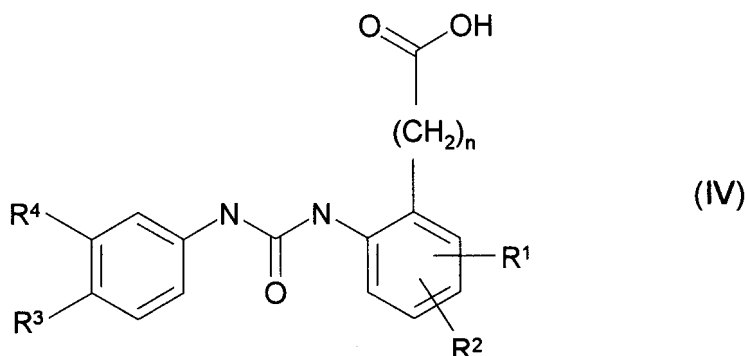
$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。}

で表わされる、請求項2記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項8】

式 IV

【化6】



{ 式中、

$n$  が0, 1又は2であり、そして

$R^1$  及び  $R^2$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  のうちの一方が水素を示す場合、 $R^1$  及び  $R^2$  のうちの他方は水素と異なり、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってメチレンジオキシ環又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$

(式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体を形成するか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。}

で表わされる、請求項7記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項9】

$n$  が0, 1又は2であり、そして

$R^1$  及び  $R^2$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  のうちの一方が水素を示す場合、 $R^1$  及び  $R^2$  のうちの他方は水素と異なり、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になって構造  $-O-CH_2-O-$  で表わされるメチレンジオキシ環を形成するか、又は

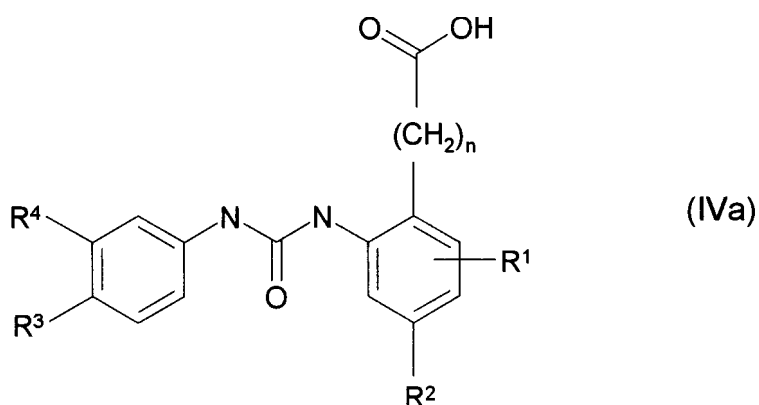
$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、ヒドロキシ、アルコキシ及びハロアルキルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている

、  
請求項8記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項10】

式 IVa

【化7】



{ 式中、

n が0又は1であり、そして

R<sup>1</sup> が水素、ハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

R<sup>2</sup> がハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が相互に独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルキル又はフェニルを示すか、又は

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が一緒になって構造 -O-CH<sub>2</sub>-O- で表わされるメチレンジオキシ環を形成するか、又は

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、ヒドロキシ、アルコキシ及びハロアルキルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。

}

で表わされる、請求項9記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項11】

4-クロロ-2-(3-フェニル-ウレイド)-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(2-メトキシ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

2-(3-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-ウレイド)-4-クロロ-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

2-(3-ビフェニル-2-イル-ウレイド)-4-クロロ-安息香酸；

2-(3-ビフェニル-4-イル-ウレイド)-4-クロロ-安息香酸；

2-[3-(2-ブromo-フェニル)-ウレイド]-4-クロロ-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(4-フルオロ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(4-ヨード-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(4-クロロ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(3-ヨード-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(4-メトキシ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(3-クロロ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-(3-ナフタレン-2-イル-ウレイド)-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(2-ヨード-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

2-(3-ビフェニル-3-イル-ウレイド)-4-クロロ-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(4-ヒドロキシ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(3-ヒドロキシ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；

4-クロロ-2-[3-(2-ヒドロキシ-フェニル)-ウレイド]-安息香酸又は

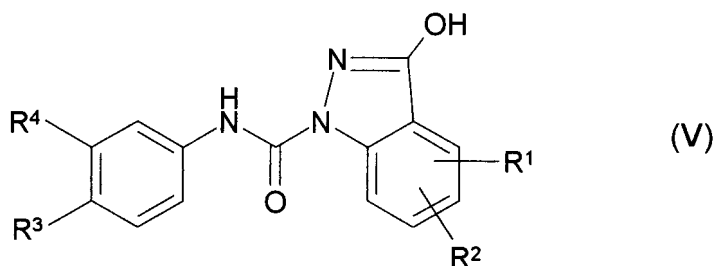
{2-[3-(3-ブromo-フェニル)-ウレイド]-4-クロロ-フェニル}-酢酸

又はその対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項10記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項12】

式 V

【化8】



{ 式中、

$R^1$  及び  $R^2$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  のうちの一方が水素を示す場合、 $R^1$  及び  $R^2$  のうちの他方は水素と異なり、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってメチレンジオキシ環又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体を形成するか、又は

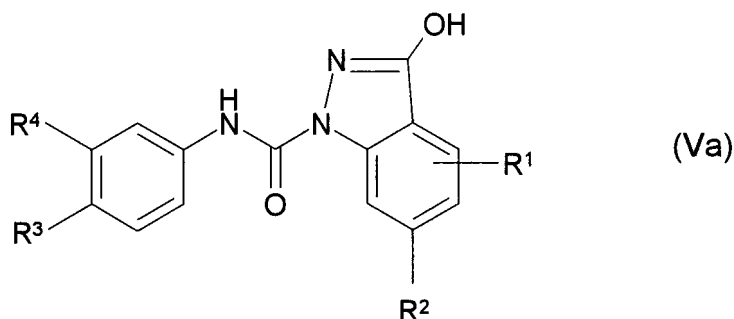
$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。}

で表わされるフェニルカルバモイルインダゾール誘導体である、請求項7記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項13】

式 Va

【化9】



{ 式中、

$R^1$  が水素、ハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、

$R^2$  がハロ、アルキル又はシクロアルキルを示し、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になって構造  $-O-CH_2-O-$  で表わされるメチレンジオキシ環を形成するか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、ヒドロキシ、アルコキシ及びハロアルキルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。

}

で表わされる、請求項12記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。



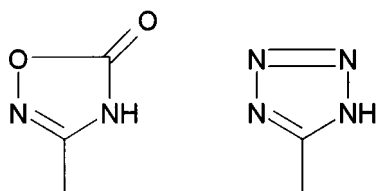
## 【請求項 14】

6-クロロ-3-ヒドロキシ-インダゾール-1-カルボン酸ナフタレン-2-イルアミド  
又はその対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項13記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

## 【請求項 15】

AC が構造

## 【化 10】



又は

で表わされるヘテロ環状環を示し、そして

R' が水素又はアルキルを示し、そして

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> のうち的一方が水素を示す場合、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> のうち他方は水素と異なり、そして

AR が芳香族単環状、二環状又は多環状の炭素環状又はヘテロ環状基を示し、

この芳香族基は場合によりハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルより成る群から選ばれた置換基によって1回以上置換されているか、又は

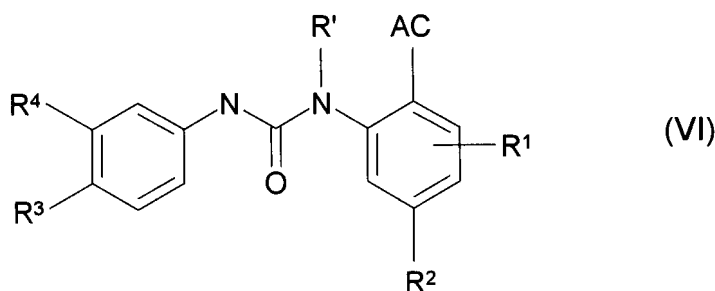
この芳香族基は場合によりメチレンジオキシ基又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、m は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体によって置換されている、

請求項1記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

## 【請求項 16】

式 VI

## 【化 11】

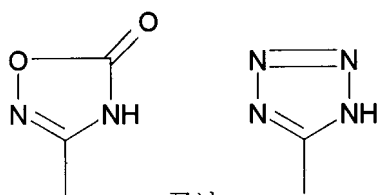


(VI)

{ 式中、

ACが構造

## 【化 12】



又は

で表わされるヘテロ環状環を示し、そして

R' が水素又はアルキルを示し、

R<sup>1</sup> が水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、

$R^2$  がハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^3$  及び  $R^4$  が相互に独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルキル又はフェニルを示すか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になって構造  $-O-CH_2-O-$  で表わされるメチレンジオキシ環を形成するか、又は

$R^3$  及び  $R^4$  が一緒になってベンゾ縮合環を形成し、この縮合環は場合によりハロ、ヒドロキシ、アルコキシ及びハロアルキルから選ばれた置換基によって1回以上置換されている。  
}

で表わされる、請求項15記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項 17】

1-[5-クロロ-2-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル)-フェニル]-3-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-尿素；

1-[5-クロロ-2-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル)-フェニル]-3-(3-プロモ-フェニル)-尿素；

1-[5-クロロ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]-3-ナフタレン-2-イル-尿素又は

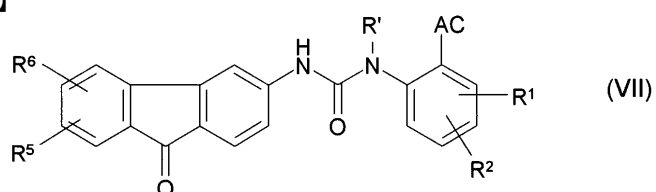
1-[5-クロロ-2-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル)-フェニル]-3-ナフタレン-2-イル-尿素

又はその対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項16記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項 18】

式 VII

【化 13】



{ 式中、

AC が、

$-SO_2OH$ ；

$-SO_2NH_2$ ；

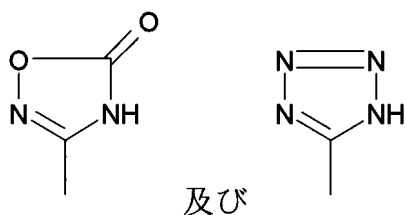
式  $-(CH_2)_nCOOH$  (式中、 $n$  は0, 1, 2 又は3である。) で表わされる基；

式  $-(CX)OH$

(式中、 $X$ はO 又は  $NR'$  を示し、この際  $R'$  は水素又はアルキルを示すか又は $X$ は $R'$  と一緒になってヘテロ環状環を形成する。)

で表わされる基及び構造

【化 14】



で表わされるヘテロ環状環から選ばれる酸性基を示し、そして

$R'$  が水素又はアルキルを示すか、又は

$R'$  及び  $X$ が一緒になってヘテロ環状環を形成し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^1$  及び  $R^2$  のうち的一方が水素を示す場合、 $R^1$  及び  $R^2$  のうち他方は水素と異なり、そして

$R^5$  及び  $R^6$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルを示すか、又は

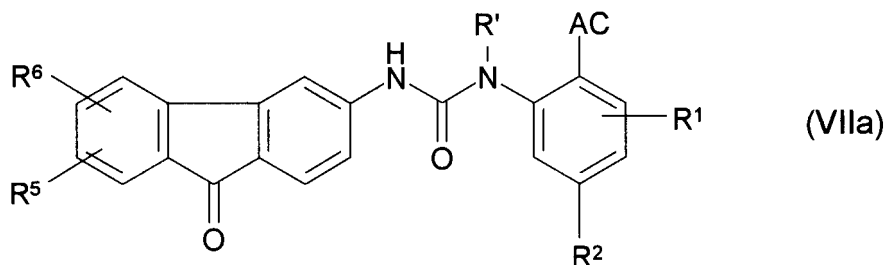
$R^5$  及び  $R^6$  が一緒になってメチレンジオキシ環又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体を形成する。}

で表わされる、請求項1記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項 19】

式 VIIa

【化 15】



{ 式中、AC が  $-(CH_2)_nCOOH$  (式中、 $n$  は0, 1又は2である。) で表わされる基を示し、そして

$R'$  が水素又はアルキルを示し、そして

$R^1$  が水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^2$  がハロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ニトロ又はシアノを示し、そして

$R^5$  及び  $R^6$  が相互に独立して水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ 及び(又は) ハロアルキルを示す。}

で表わされる、請求項18記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項 20】

4-クロロ-2-[3-(9-オキソ-9H-フルオレン-3-イル)-ウレイド]-安息香酸、又はその対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項19記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項 21】

AR が芳香族単環状、二環状又は多環状ヘテロ環状基を示し、この芳香族ヘテロ環状基は場合によりハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、オキソ、ハロアルキル、ニトロ、シアノ、フェニル又はベンジルより成る群から選ばれた置換基によって1回以上置換されているか、又は

この芳香族基は場合によりメチレンジオキシ基 又は構造  $-O-(CH_2)_m-O-$  (式中、 $m$  は1, 2又は3である。) で表わされる高級同族体によって置換されており、そして

AC,  $R'$ ,  $R^1$  及び  $R^2$  が請求項1に定義された通りである、請求項1記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項 22】

ARが

フラニル、チエニル 及び ピロリルから選ばれる芳香族5-員の単環状ヘテロ環状基； 又は

ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル及びピラジニルから選ばれる芳香族6-員の単環状ヘテロ環状基； 又は

インドリル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チエニル、ベンジイミダゾリル及びベンゾチアゾリルから選ばれる芳香族二環状ヘテロ環状基を示し、

この芳香族ヘテロ環状基は場合によりハロ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル

-アルキル, アルケニル, アルキニル, ヒドロキシ, アルコキシ, オキソ, ハロアルキル, ニトロ, シアノ, フェニル又はベンジルより成る群から選ばれた置換基によって1回以上置換されており、そして

AC, R', R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup>が請求項1に定義された通りである、  
請求項21記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項23】

AC が -SO<sub>2</sub>OH; -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>; 又は式  $-(CH_2)_nCOOH$  (式中、n は0, 1又は2である。) で表わされる基を示し、そして

R' が水素又はアルキルを示し、そして

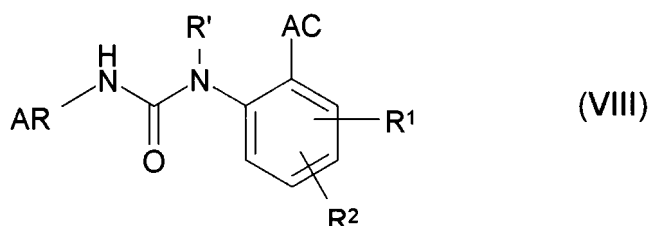
R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup>が互に独立して水素, ハロ, アルキル, シクロアルキル, ハロアルキル, ニトロ又はシアノを示し、そして

R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup>のうち的一方が水素を示す場合、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>のうちの他方は水素と異なる、  
請求項22記載のアリールウレイド誘導体。

【請求項24】

式 VIII

【化16】



{ 式中、

AC が -SO<sub>2</sub>OH, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 又は -COOHを示し、そして

R' が水素又はアルキルを示し、そして

R<sup>1</sup> が水素, ハロ, アルキル, シクロアルキル, ハロアルキル, ニトロ又はシアノを示し、そして

R<sup>2</sup> がハロ, アルキル, シクロアルキル, ハロアルキル, ニトロ又はシアノを示し、そして

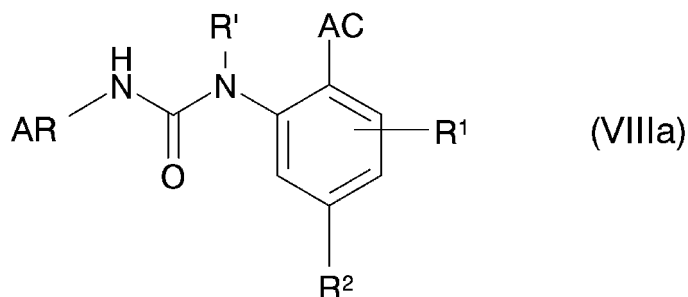
ARがチエニル, ピリジル又はインドリルを示す。 }

で表わされる、請求項23記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

【請求項25】

式 VIIIa

【化17】



{ 式中、

AC が -SO<sub>2</sub>OH, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 又は -COOHを示し、そして

R' が水素又はアルキルを示し、そして

R<sup>1</sup> が水素, ハロ, アルキル, シクロアルキル又はハロアルキルを示し、そして

R<sup>2</sup> がハロ, アルキル, シクロアルキル 又はハロアルキルを示し、そして

AR が2-又は3-チエニル, 2-, 3-又は4-ピリジルあるいは2-又は3-インドリルを示す。 }

で表わされる、請求項23記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

## 【請求項 26】

4-クロロ-2-[3-(2-ヨード-フェニル)-ウレイド]-安息香酸；  
4-クロロ-2-(3-チオフェン-2-イル-ウレイド)-安息香酸；  
4-クロロ-2-(3-ピリジン-2-イル-ウレイド)-安息香酸；  
4-クロロ-2-[3-(1H-インドール-2-イル)-ウレイド]-5-メチル-ベンゼンスルホン酸又は  
4-クロロ-2-[3-(1H-インドール-2-イル)-ウレイド]-ベンゼンスルホン酸  
又はその対掌体又はその対掌体の混合物、又はその薬学的に許容し得る付加塩である、請求項25記載のアリールウレイド安息香酸誘導体。

## 【請求項 27】

請求項1-26のいずれか1つに記載の化合物又はその薬学的に許容し得る付加塩の治療上有効な量を含む医薬調合物。

## 【請求項 28】

請求項1-26のいずれか1つに記載の化合物又はその薬学的に許容し得る付加塩を医薬調合物/医薬の製造に使用する方法。

## 【請求項 29】

ヒトを含めた哺乳類の疾患又は障害又は病態                      この疾患又は障害又は病態はイオン調節型 GluR5 受容体のモジュレーションに応答する                      の治療、予防又は緩和用医薬調合物/薬剤の製造に請求項1-26のいずれか1つに記載の化合物又はその薬学的に許容し得る付加塩を使用する方法。

## 【請求項 30】

疾患、障害又は病態が慢性痛又は急性痛，神経障害性疼痛，難治性疼痛，偏頭痛様頭痛，神経及び精神障害，鬱病、不安，精神病、統合失調症，興奮性アミノ酸依存性精神病，認知障害、痴呆症，老人性痴呆症，AIDS誘発性痴呆症，ストレス関連の精神障害，発作，全身性及び局所性虚血性又は出血性発作，脳低酸素症/虚血；血栓塞栓症発作又は出血性発作に起因する脳梗塞又は脳虚血，心筋梗塞，脳損傷，脳水腫，頭蓋/脳損傷，脊髄損傷，骨髄病変，低血糖症，酸素欠乏症；低血糖症，低血圧，低酸素症，周産期低酸素症，心不全，急性及び慢性神経変性疾患又は障害及び種々の起源の脳虚血後のニューロン損傷，CNS 変性疾患、パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンチングトン病、特発性及び薬物誘発性パーキンソン病，筋萎縮性側索硬化症(ALS)，急性期後(post-acute phase)脳病変又は神経系の慢性疾患、心臓バイパス手術及び移植後の脳欠損，周産期呼吸停止；溺死、肺疾患手術及び脳外傷に由来する酸素欠乏症，低酸素症誘発性神経細胞傷害（たとえば心不全又はバイパス手術，あるいは 新生児苦痛において），癲癇，癲癇重積症，発作性疾患，脳血管けいれん，CNS-依存性けいれん，消化管運動異常，筋肉けいれん，尿失禁，痙攣，抗痙攣剤に応答する障害，自動免疫疾患，嘔吐，吐き気，肥満，薬物(chemical)依存及び嗜癖，嗜癖及び禁断症状，薬物(drug)又はアルコール誘発性欠損，薬物(drug)嗜癖，眼の損傷，網膜症，網膜神経症，耳鳴り，遅発性ジスキネジーである、請求項29記載の使用する方法。

## 【請求項 31】

障害，疾患又は病態が慢性又は急性痛，神経障害性疼痛，難治性疼痛，偏頭痛又は偏頭痛様頭痛である、請求項29記載の使用する方法。

## 【請求項 32】

障害、疾患又は病態が癲癇，癲癇重積症又は発作性疾患である、請求項29記載の使用する方法。